

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

## 食後過血糖改善剤

日本薬局方 ボグリボース錠

**ボグリボース錠0.2mg「サワイ」**

**ボグリボース錠0.3mg「サワイ」**

VOGLIBOSE

**ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」**

**ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」**

VOGLIBOSE OD

ボグリボース口腔内崩壊錠

剤形	錠0.2mg：割線入り素錠 錠0.3mg：素錠 OD錠0.2mg：割線入り素錠(口腔内崩壊錠) OD錠0.3mg：素錠(口腔内崩壊錠)
製剤の規制区分	処方箋医薬品※ ※注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	錠0.2mg/OD錠0.2mg：1錠中日局ボグリボース0.2mg含有 錠0.3mg/OD錠0.3mg：1錠中日局ボグリボース0.3mg含有
一般名	和名：ボグリボース 洋名：Voglibose
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2011年2月15日(錠0.2mg/錠0.3mg：販売名変更) 2007年3月15日(OD錠0.2mg/OD錠0.3mg) 薬価基準収載年月日：2011年11月28日(錠0.2mg/錠0.3mg：販売名変更) 2007年7月6日(OD錠0.2mg/OD錠0.3mg) 発売年月日：2005年7月8日(錠0.2mg/錠0.3mg) 2007年7月6日(OD錠0.2mg/OD錠0.3mg)
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-6394-7355 医療関係者向け総合情報サイト： <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2018年2月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ<https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

# IF利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書(以下、添付文書と略す)がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IFと略す)の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

### [IFの様式]

①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」(以下、「IF記載要領2013」と略す)により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IFの発行]

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

### 3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

IFを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	29
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	29
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	29
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	29
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	29
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	29
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	30
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	30
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	31
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	32
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	32
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	33
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	33
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	33
3. 有効成分の確認試験法	4	14. 適用上の注意	33
4. 有効成分の定量法	5	15. その他の注意	33
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	33
1. 剤形	6	IX. 非臨床試験に関する項目	34
2. 製剤の組成	7	1. 薬理試験	34
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7	2. 毒性試験	34
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	X. 管理的事項に関する項目	36
5. 調製法及び溶解後の安定性	10	1. 規制区分	36
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	11	2. 有効期間又は使用期限	36
7. 溶出性	11	3. 貯法・保存条件	36
8. 生物学的試験法	15	4. 薬剤取扱い上の注意点	36
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	16	5. 承認条件等	37
10. 製剤中の有効成分の定量法	16	6. 包装	37
11. 力価	16	7. 容器の材質	37
12. 混入する可能性のある夾雑物	16	8. 同一成分・同効薬	37
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	16	9. 国際誕生年月日	37
14. その他	16	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	38
V. 治療に関する項目	17	11. 薬価基準収載年月日	38
1. 効能又は効果	17	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	38
2. 用法及び用量	17	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	38
3. 臨床成績	17	14. 再審査期間	38
VI. 薬効薬理に関する項目	20	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	38
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	20	16. 各種コード	39
2. 薬理作用	20	17. 保険給付上の注意	39
VII. 薬物動態に関する項目	26	XI. 文献	40
1. 血中濃度の推移・測定法	26	1. 引用文献	40
2. 薬物速度論的パラメータ	26	2. その他の参考文献	40
3. 吸収	27	XII. 参考資料	41
4. 分布	27	1. 主な外国での発売状況	41
5. 代謝	27	2. 海外における臨床支援情報	41
6. 排泄	28	XIII. 備考	41
7. トランスポーターに関する情報	28	その他の関連資料	41
8. 透析等による除去率	28		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ボグリボース錠0.2mg/錠0.3mg/OD錠0.2mg/OD錠0.3mg「サワイ」は、日局ボグリボースを含有する食後過血糖改善剤である。

ボグリボースは、 $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害薬の探究中に開発されたもので、放線菌の培養液中から発見されたvaliolamineの多くのN-置換誘導体の中から選択された。<sup>1)</sup>

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法[OD錠のみ]並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

	ボグリボース錠0.2mg/錠0.3mg 「SW」(旧販売名)	ボグリボースOD錠0.2mg/ OD錠0.3mg「サワイ」
承認申請に際し 準拠した通知名	平成11年4月8日 医薬発第481号	平成17年3月31日 薬食発第 0331015号
承認	2005年3月	2007年3月
上市	2005年7月	2007年7月

ボグリボース錠0.2mg「SW」及びボグリボース錠0.3mg「SW」は、2011年11月に『ボグリボース錠0.2mg「サワイ」』及び『ボグリボース錠0.3mg「サワイ」』にそれぞれ販売名を変更した。

2014年4月に「耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制」の効能・効果が追加承認された。[錠0.2mg/OD錠0.2mg] (X. -12. 参照)

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) PTPシートに「糖尿病用剤」及び「食直前に服用」の文字を記載している。
- 2) 水なし(唾液のみ)でも服用可能な口腔内崩壊錠である[OD錠0.2mg/OD錠0.3mg]。
- 3) 腸管において、二糖類から単糖類への分解を担う二糖類水解酵素( $\alpha$ -グルコシダーゼ)を阻害することによって、糖質の消化・吸収を遅延させ、食後過血糖を改善する。<sup>1)</sup>
- 4) 本剤は二糖類の消化・吸収を遅延するので、低血糖症状が認められた場合にはショ糖ではなくブドウ糖の投与が必要である。
- 5) 標準製剤(普通錠)を服用中の2型糖尿病患者を対象に、ボグリボース錠0.2mg「サワイ」に切り替え後の有効性及び安全性を確認する目的で群内比較試験を行った結果、本剤への切り替え後の臨床的有用性が十分に期待できる結果を得た(V. -2. 参照)。<sup>2)</sup>
- 6) 標準製剤(OD錠)を服用中の2型糖尿病患者を対象に、ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」に切り替え後の有効性及び安全性を確認する目的で群内比較試験を行った結果、本剤は標準製剤と臨床的に同等であることが確認された(V. -2. 参照)。<sup>3)</sup>
- 7) 重大な副作用として、低血糖、腸閉塞、劇症肝炎、重篤な肝機能障害、黄疸、重篤な肝硬変例における高アンモニア血症の増悪による意識障害が報告されている(頻度不明)。

## II. 名称に関する項目

---

### II. 名称に関する項目

---

#### 1. 販売名 .....

##### 1) 和名

ボグリボース錠0.2mg「サワイ」  
ボグリボース錠0.3mg「サワイ」  
ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」  
ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」

##### 2) 洋名

VOGLIBOSE  
VOGLIBOSE OD

##### 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

#### 2. 一般名 .....

##### 1) 和名(命名法)

ボグリボース(JAN)

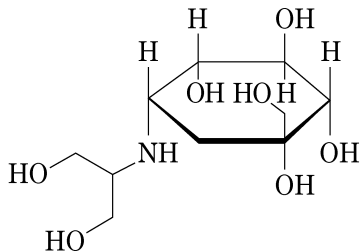
##### 2) 洋名(命名法)

Voglibose(JAN、INN)

##### 3) ステム

—gli—：スルホンアミド系でない糖尿病用剤

#### 3. 構造式又は示性式 .....



#### 4. 分子式及び分子量 .....

分子式：C<sub>10</sub>H<sub>21</sub>NO<sub>7</sub>  
分子量：267.28

5. 化学名(命名法) .....  
3,4-Dideoxy-4-[2-hydroxy-1-(hydroxymethyl)ethylamino]-2-C-(hydroxymethyl)-D-  
*epi*-inositol (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....  
特になし

7. CAS登録番号 .....  
83480-29-9

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

### 1. 物理化学的性質

#### 1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

#### 2) 溶解性

水に極めて溶けやすく、酢酸(100)に溶けやすく、メタノールに溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。0.1mol/L塩酸試液に溶ける。

溶媒	本品 1 gを溶解するための溶媒量
水	1 mL以下
酢酸(100)	約 3 mL
メタノール	約350mL

ジエチルエーテルにはほとんど溶けない。<sup>1)</sup>

#### 3) 吸湿性

水分：0.2%以下(0.5g、電量滴定法)

#### 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：163～168℃

#### 5) 酸塩基解離定数

pKa=7.06(イミノ基、25℃)

#### 6) 分配係数

該当資料なし

#### 7) その他の主な示性値

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ ：+45～+48°(脱水物に換算したもの0.2g、0.1mol/L塩酸試液、20mL、100mm)

pH：本品1.0gを水10mLに溶かした液のpHは9.8～10.4である。

本品はイミノ基を有する塩基性化合物であり、その10%水溶液のpHは約10である。<sup>1)</sup>

### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

### 3. 有効成分の確認試験法

日局「ボグリボース」の確認試験に準ずる。

1) 赤外吸収スペクトル測定法

2) 核磁気共鳴スペクトル測定法















4. 有効成分の定量法 .....  
日局「ボグリボース」の定量法に準ずる。(電位差滴定法)

IV. 製剤に関する項目

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別、外観及び性状

品名	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
ボグリボース錠 0.2mg「サワイ」	割線入り素錠	 7.0	 約115	 2.4	白色～帯黄白色
ボグリボース錠 0.3mg「サワイ」	素錠	 8.0	 約170	 2.7	白色～帯黄白色
ボグリボース OD錠0.2mg 「サワイ」	割線入り素錠 (口腔内崩壊錠)	 7.5	 約140	 3.8	帯黄白色
ボグリボース OD錠0.3mg 「サワイ」	素錠(口腔内崩 壊錠)	 8.5	 約200	 4.4	微黄色

2) 製剤の物性

●ボグリボース錠0.2mg/錠0.3mg「サワイ」

製剤均一性：日局ボグリボース錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局ボグリボース錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

●ボグリボースOD錠0.2mg/OD錠0.3mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

3) 識別コード

●ボグリボース錠0.2mg「サワイ」：SW VG2

●ボグリボース錠0.3mg「サワイ」：SW VG3

●ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」：SW V2

●ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」：SW V3

4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

## 2. 製剤の組成

## 1) 有効成分(活性成分)の含量

- ボグリボース錠0.2mg「サワイ」：1錠中に日局ボグリボース0.2mgを含有する。
- ボグリボース錠0.3mg「サワイ」：1錠中に日局ボグリボース0.3mgを含有する。
- ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」：1錠中に日局ボグリボース0.2mgを含有する。
- ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」：1錠中に日局ボグリボース0.3mgを含有する。

## 2) 添加物

## ●ボグリボース錠0.2mg「サワイ」

添加物として、ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

## ●ボグリボース錠0.3mg「サワイ」

添加物として、ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

## ●ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」

添加物として、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、還元麦芽糖水アメ、軽質無水ケイ酸、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、マルトース、D-マンニトールを含有する。

## ●ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」

添加物として、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、還元麦芽糖水アメ、軽質無水ケイ酸、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、マルトース、D-マンニトールを含有する。

## 3) その他

## ●ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」

熱量：1錠あたり、約0.80kcalである。(分析結果より算出)

## 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## 4. 製剤の各種条件下における安定性

●ボグリボース錠0.2mg「サワイ」<sup>4)</sup>

## 1) PTP包装品の安定性(加速試験)

ボグリボース錠0.2mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色～帯黄白色の割線入り素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
定量試験※	101.5	101.5

※：表示量に対する含有率(%)

#### IV. 製剤に関する項目

##### 2)バラ包装品の安定性(加速試験)

ボグリボース錠0.2mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色～帯黄白色の割線入り素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
定量試験※	101.5	99.9

※：表示量に対する含有率(%)

##### 3)無包装下の安定性

ボグリボース錠0.2mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	なりゆき (室温散光下 3ヵ月)
性状	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	3.3	3.5	3.3	2.8	2.9
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.6	100.1	101.0	99.6

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

#### ●ボグリボース錠0.3mg「サワイ」<sup>5)</sup>

##### 1)PTP包装品の安定性(加速試験)

ボグリボース錠0.3mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色～帯黄白色の素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
定量試験※	101.2	101.4

※：表示量に対する含有率(%)

##### 2)バラ包装品の安定性(加速試験)

ボグリボース錠0.3mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色～帯黄白色の素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.1	101.3

※：表示量に対する含有率(%)

## 3)無包装下の安定性

ボグリボース錠0.3mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	なりゆき (室温散光下 3ヵ月)
性状	白色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	4.7	4.9	4.5	3.8	3.5
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.4	99.1	99.5	99.8

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」<sup>6)</sup>

## 1)PTP包装品の安定性(加速試験)

ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ箔、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	帯黄白色の割線入り口腔内崩壊錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.8	97.5

※：表示量に対する含有率(%)

## 2)無包装下の安定性

ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件下で崩壊時間の延長、なりゆきの条件下で硬度低下が観察された。

IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C 75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	なりゆき (室温散光下 3 ヶ月)
性 状	帯黄白色の 割線入り口 腔内崩壊錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度 (kg)	4.8	3.9	3.7	3.8	3.3
崩壊時間	0.4分	0.4分	2.1分	0.4分	0.5分
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	97.7	99.6	97.1	99.3

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」<sup>7)</sup>

1) PTP包装品の安定性(加速試験)

ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ箔、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C 75%RH・遮光 6 ヶ月
性 状	微黄色の口腔内崩壊錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.5	97.8

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性

ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件下で崩壊時間の延長が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C 75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	なりゆき (室温散光下 3 ヶ月)
性 状	微黄色の口 腔内崩壊錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度 (kg)	4.8	6.8	5.5	5.8	5.4
崩壊時間	0.4分	0.9分	4.0分	0.5分	0.6分
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	97.5	100.0	97.9	100.0

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

5. 調製法及び溶解後の安定性 .....  
該当しない

## 6. 他剤との配合変化(物理化学的变化).....

該当資料なし

## 7. 溶出性.....

&lt;溶出挙動における同等性及び類似性&gt;

●ボグリボース錠0.2mg「サワイ」<sup>8)</sup>

本製剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成13年5月31日 医薬 審発第786号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH5.0)
試験回数	12 ベッセル	

## 【結果及び考察】

&lt;50rpm：pH1.2&gt;

標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (15分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

&lt;50rpm：pH5.0&gt;

標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (20分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

&lt;50rpm：pH6.8&gt;

標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (15分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

&lt;50rpm：水&gt;

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

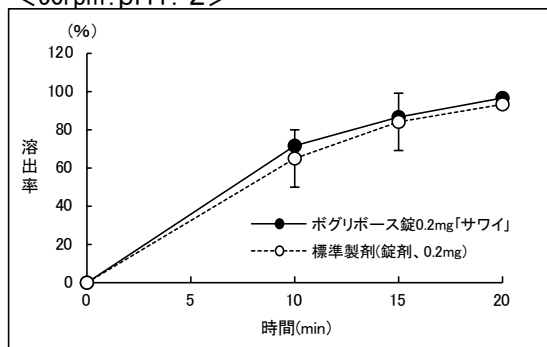
&lt;100rpm：pH5.0&gt;

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

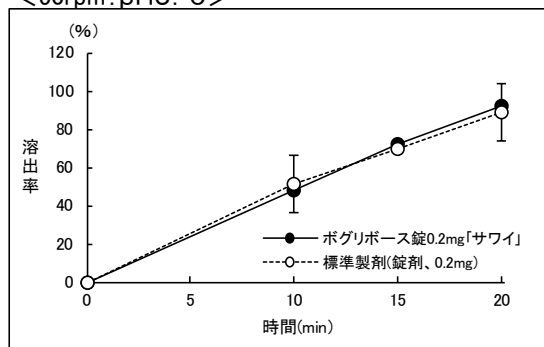
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

## (溶出曲線)

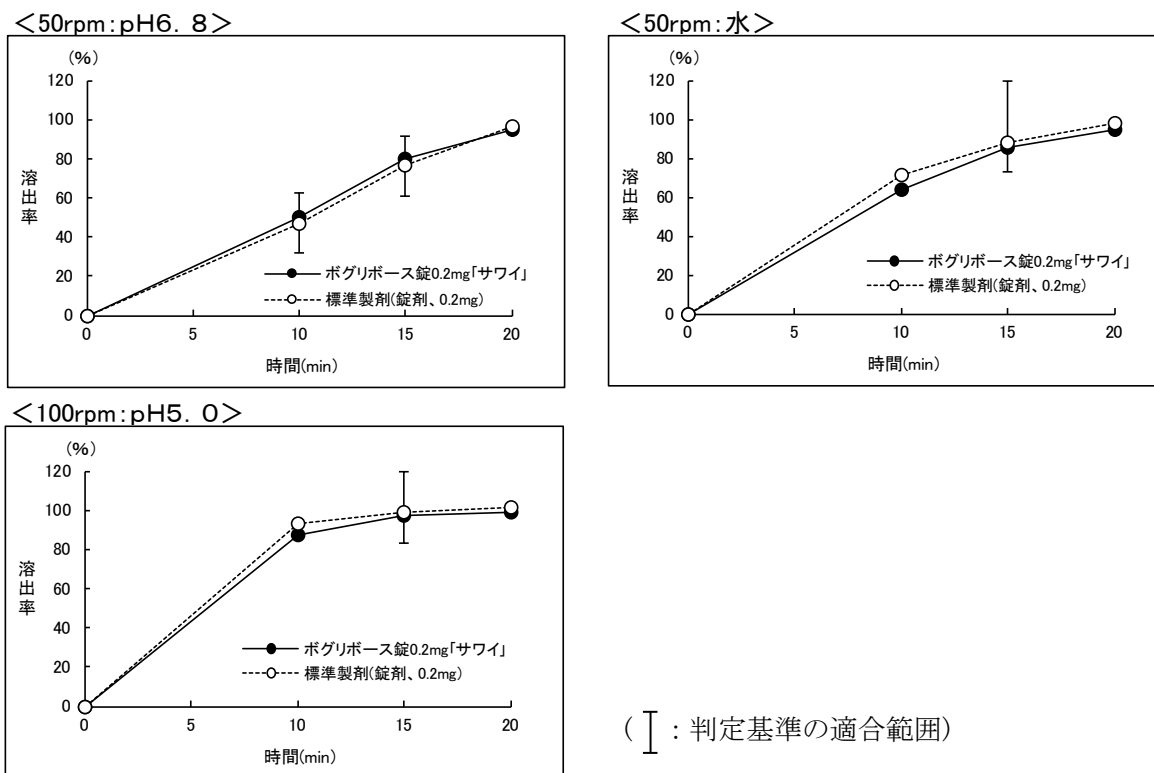
&lt;50rpm:pH1.2&gt;



&lt;50rpm:pH5.0&gt;



#### IV. 製剤に関する項目



#### ●ボグリボース錠0.3mg「サワイ」<sup>9)</sup>

本製剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成13年5月31日 医薬審発第786号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm (pH6.8)
試験回数	12ベッセル	

#### 【結果及び考察】

<50rpm : pH1.2>

標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (15分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

<50rpm : pH5.0>

標準製剤の平均溶出率が60% (15分) 及び85% (20分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

<50rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が60% (15分) 及び85% (20分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

<50rpm : 水>

標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (20分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

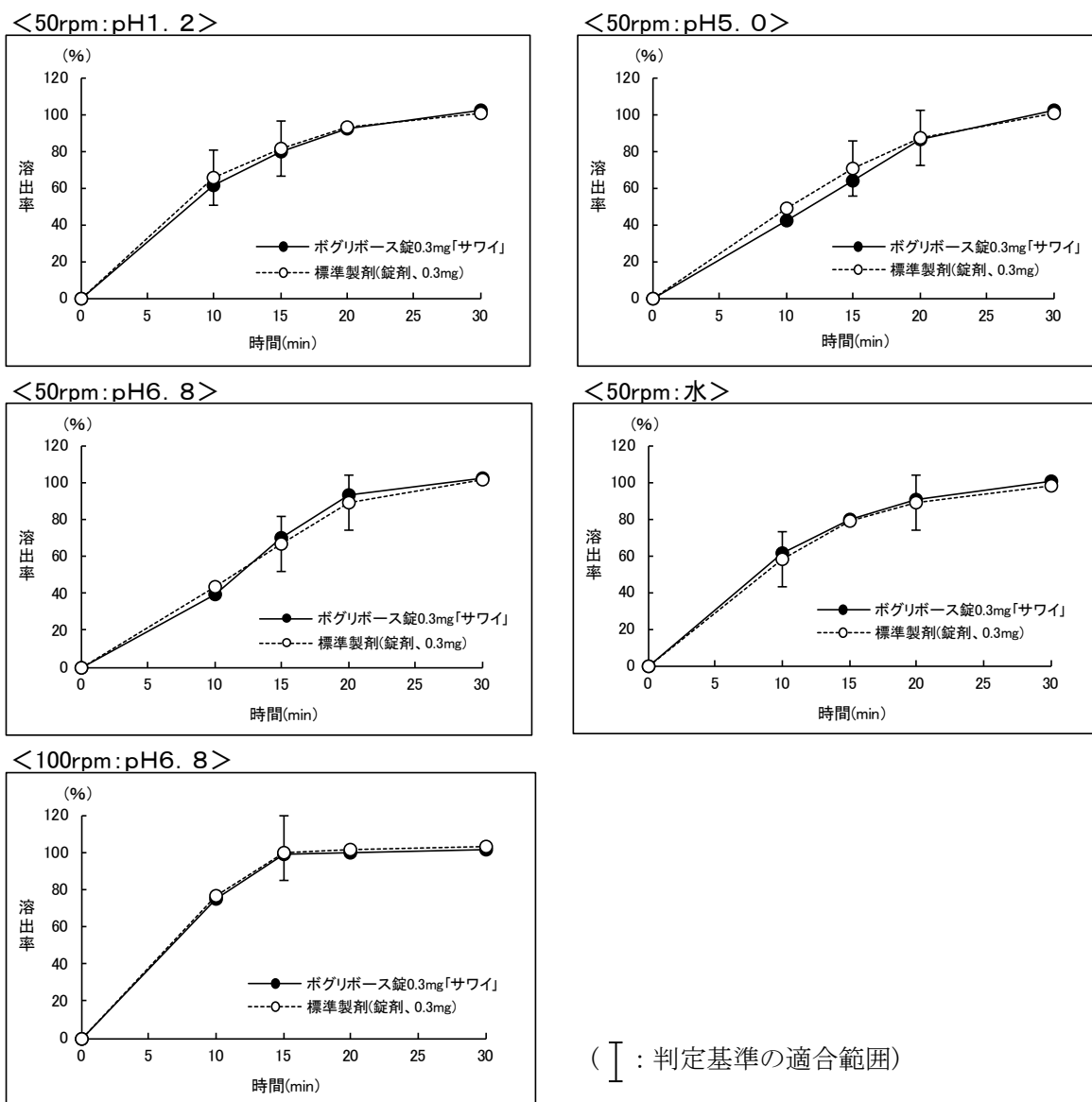
<100rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。



(溶出曲線)



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

● **ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」**<sup>10, 11)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成13年5月31日 医薬審発第786号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1. 2、5. 0、6. 8、水)、100rpm (pH5. 0)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1. 2>  
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH5. 0>  
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH6. 8>  
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : 水>  
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

#### IV. 製剤に関する項目

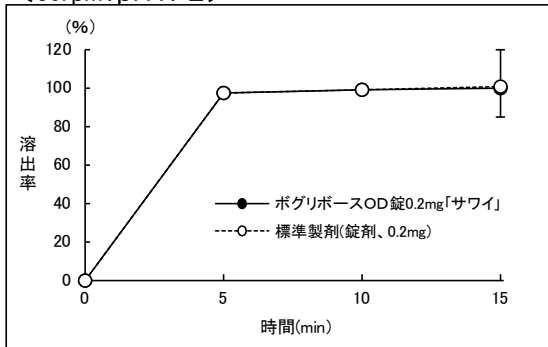
<100rpm : pH5. 0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

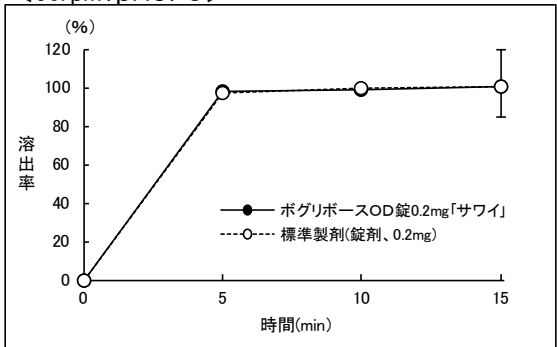
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

(溶出曲線)

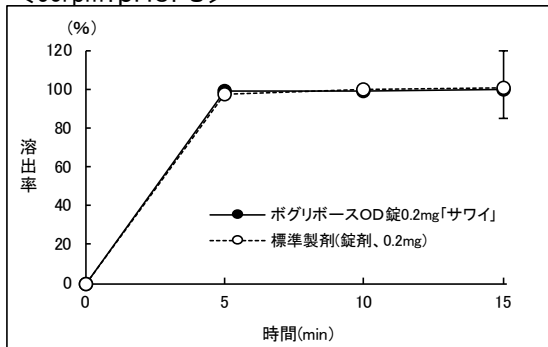
<50rpm : pH1. 2>



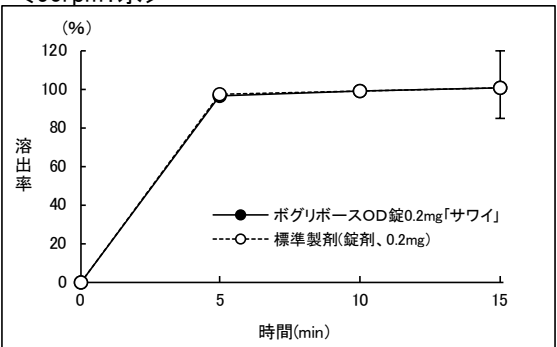
<50rpm : pH5. 0>



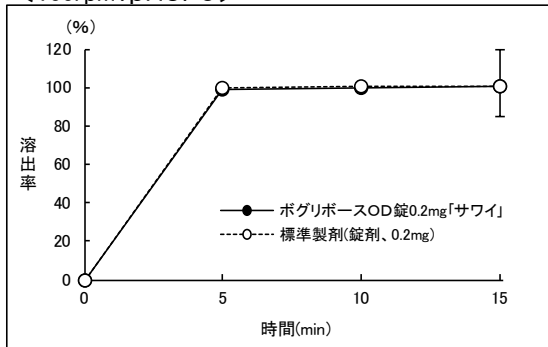
<50rpm : pH6. 8>



<50rpm : 水>



<100rpm : pH5. 0>



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

#### ●ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」<sup>10,12)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成13年5月31日 医薬 審発第786号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、4.0、6.8、水)、100rpm (pH6.8)
試験回数	12 ベッセル	

#### 【結果及び考察】

<50rpm : pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH4.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH6. 8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

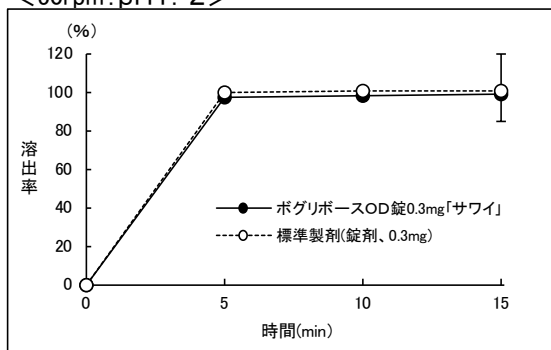
<100rpm : pH6. 8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

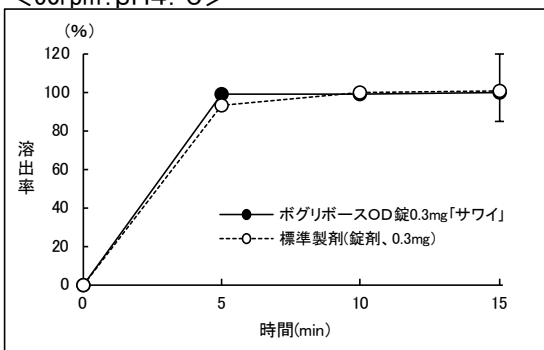
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

(溶出曲線)

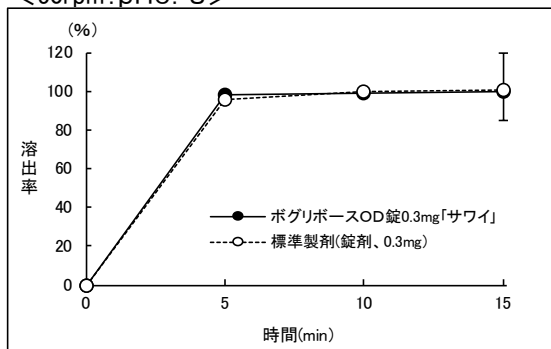
<50rpm : pH1. 2>



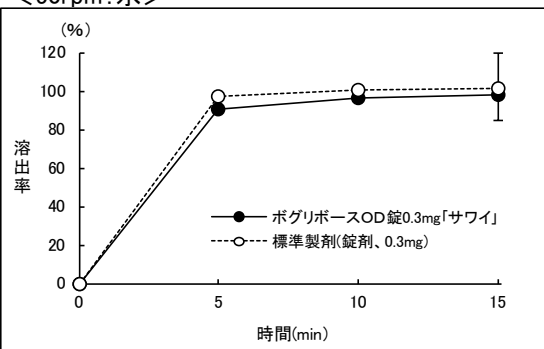
<50rpm : pH4. 0>



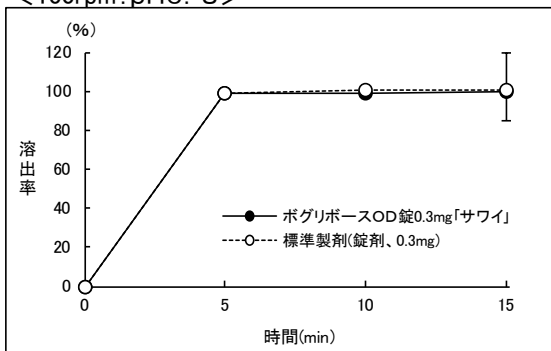
<50rpm : pH6. 8>



<50rpm : 水>



<100rpm : pH6. 8>



( I : 判定基準の適合範囲)

8. 生物学的試験法

該当しない

#### IV. 製剤に関する項目

##### 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- ボグリボース錠0.2mg/錠0.3mg「サワイ」  
日局「ボグリボース錠」の確認試験に準ずる。(薄層クロマトグラフィー)
- ボグリボースOD錠0.2mg/OD錠0.3mg「サワイ」  
液体クロマトグラフィー

##### 10. 製剤中の有効成分の定量法

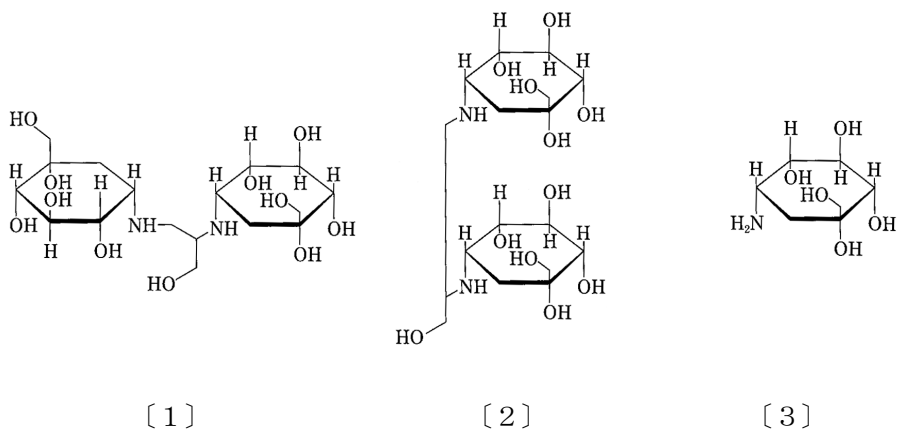
- ボグリボース錠0.2mg/錠0.3mg「サワイ」  
日局「ボグリボース錠」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)
- ボグリボースOD錠0.2mg/OD錠0.3mg「サワイ」  
液体クロマトグラフィー

##### 11. 力価

該当しない

##### 12. 混入する可能性のある夾雑物

混在が予想される類縁物質には次の〔1〕～〔3〕のようなものがある。<sup>1)</sup>



##### 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

##### 14. その他

低血糖に備え、ブドウ糖を用意している。

1袋あたりの熱量：約40kcal

注意：ブドウ糖は医薬品ではありません。

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### ○糖尿病の食後過血糖の改善

(ただし、食事療法・運動療法を行っている患者で十分な効果が得られない場合、又は食事療法・運動療法に加えて経口血糖降下剤若しくはインスリン製剤を使用している患者で十分な効果が得られない場合に限る)

#### ○耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制[錠0.2mg/OD錠0.2mgのみ]

(ただし、食事療法・運動療法を十分に行っても改善されない場合に限る)

#### <効能又は効果に関連する使用上の注意>

##### 耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制の場合[錠0.2mg/OD錠0.2mgのみ]

本剤の適用は、耐糖能異常(空腹時血糖が126mg/dL未満かつ75g経口ブドウ糖負荷試験の血糖2時間値が140～199mg/dL)と判断され、糖尿病発症抑制の基本である食事療法・運動療法を3～6ヵ月間行っても改善されず、かつ高血圧症、脂質異常症(高トリグリセリド血症、低HDLコレステロール血症等)、肥満(Body Mass Index : BMI 25kg/m<sup>2</sup>以上)、2親等以内の糖尿病家族歴のいずれかを有する場合に限定すること。

### 2. 用法及び用量

#### ○糖尿病の食後過血糖の改善の場合

通常、成人にはボグリボースとして1回0.2mgを1日3回毎食直前に経口投与する。なお、効果不十分な場合には、経過を十分に観察しながら1回量を0.3mgまで増量することができる。

#### ○耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制の場合[錠0.2mg/OD錠0.2mgのみ]

通常、成人にはボグリボースとして1回0.2mgを1日3回毎食直前に経口投与する。

#### <用法及び用量に関連する使用上の注意>

##### 全効能共通[OD錠0.2mg/OD錠0.3mgのみ]

本剤は口腔内で崩壊するが、口腔の粘膜から吸収されることはないため、唾液又は水で飲み込むこと。(「適用上の注意」の項参照)

##### 耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制の場合[錠0.2mg/OD錠0.2mgのみ]

本剤投与中は適切な間隔で血糖管理に関する検査を行い、常に投与継続の必要性に注意すること。(「重要な基本的注意」の項参照)

### 3. 臨床成績

#### 1) 臨床データパッケージ

該当しない

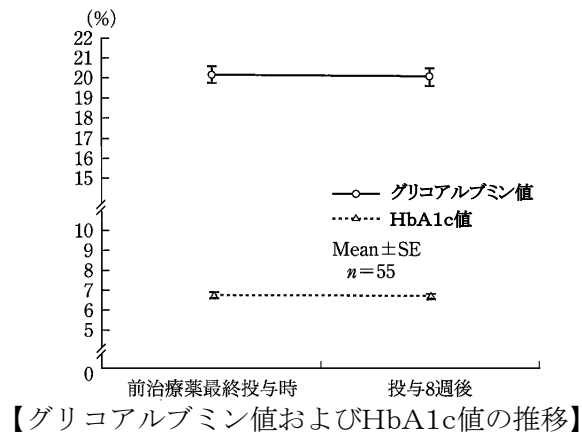
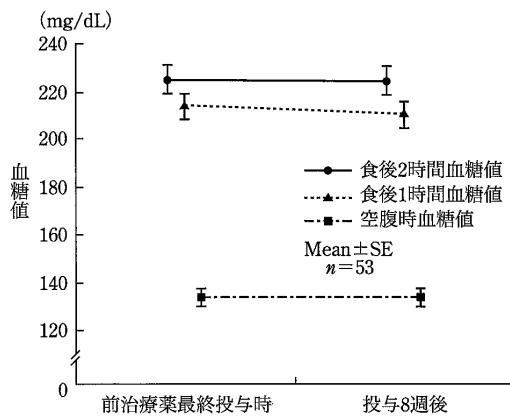
V. 治療に関する項目

2) 臨床効果

●ボグリボース錠0.2mg「サワイ」

標準製剤(普通錠)を8週間以上服用している2型糖尿病患者57例を対象に、ボグリボース錠0.2mg「サワイ」へ切り替えを行い、8週間投与における有効性および安全性を確認する目的で群内比較試験を実施した。

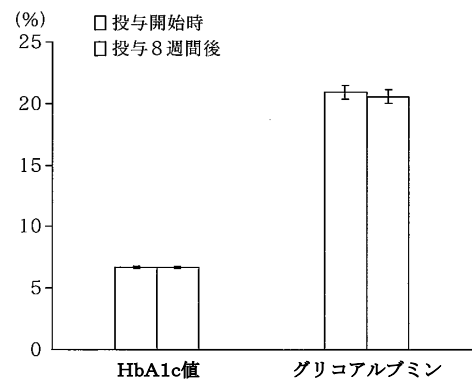
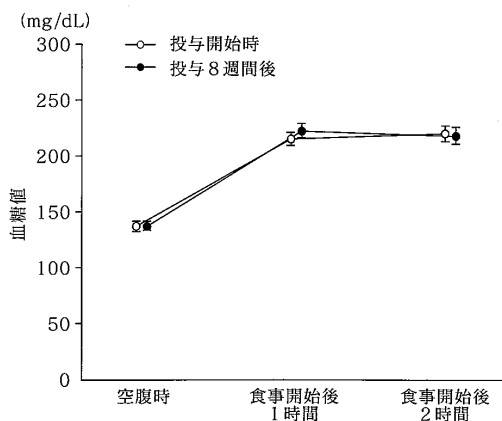
標準製剤の最終投与時と本剤に切り替え後8週間投与時を比較したところ、空腹時血糖値、食後1時間血糖値、食後2時間血糖値、グリコアルブミン値、HbA1c(JDS値)のいずれにおいても、上昇は認められなかった。副作用は、57例中4例が因果関係を否定できないものであったが、いずれも軽度～中等度であった。以上の結果より、2型糖尿病患者における本剤への切り替え後の臨床的有用性が十分に期待できる結果を得た。<sup>2)</sup>



●ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」

標準製剤(OD錠)を8週間以上服用している2型糖尿病患者44例を対象に、ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」へ切り替えを行い、8週間投与における有効性および安全性を確認する目的で群内比較試験を実施した。

標準製剤の最終投与時と本剤に切り替え後8週間投与時を比較したところ、空腹時血糖値、食後1時間血糖値、食後2時間血糖値、グリコアルブミン値、HbA1c(JDS値)のいずれにおいても上昇は認められず、同等の血糖コントロールが得られた。副作用は、44例中1例3件が因果関係を否定できないものであったが、いずれも軽度であった。以上の結果より、本剤は標準製剤と臨床的に同等であることが確認された。<sup>3)</sup>



【血糖値の推移】  
(n=44、平均値±標準誤差)

【グリコアルブミン値およびHbA1c値の推移】  
(n=44、平均値±標準誤差)

3) 臨床薬理試験

該当資料なし

4) 探索的試験

該当資料なし

5) 検証的試験

(1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

(2) 比較試験

該当資料なし

(3) 安全性試験

該当資料なし

(4) 患者・病態別試験

該当資料なし

6) 治療的使用

(1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

該当資料なし

(2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

## 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

$\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤：アカルボース、ミグリトール

## 2. 薬理作用

## 1) 作用部位・作用機序

ボグリボースの薬理作用について以下のとおり報告されている。

腸管において、二糖類から単糖類への分解を担う二糖類水解酵素( $\alpha$ -グルコシダーゼ)を阻害することによって、糖質の消化・吸収を遅延させ、食後過血糖を改善する。<sup>1)</sup>

## 2) 薬効を裏付ける試験成績

## &lt;薬力学的同等性試験&gt;

●ボグリボース錠0.2mg「サワイ」<sup>13,14)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、15、30、45、60、90、120min
休薬期間	3日間
測定方法	酵素法(Glu-DH法)

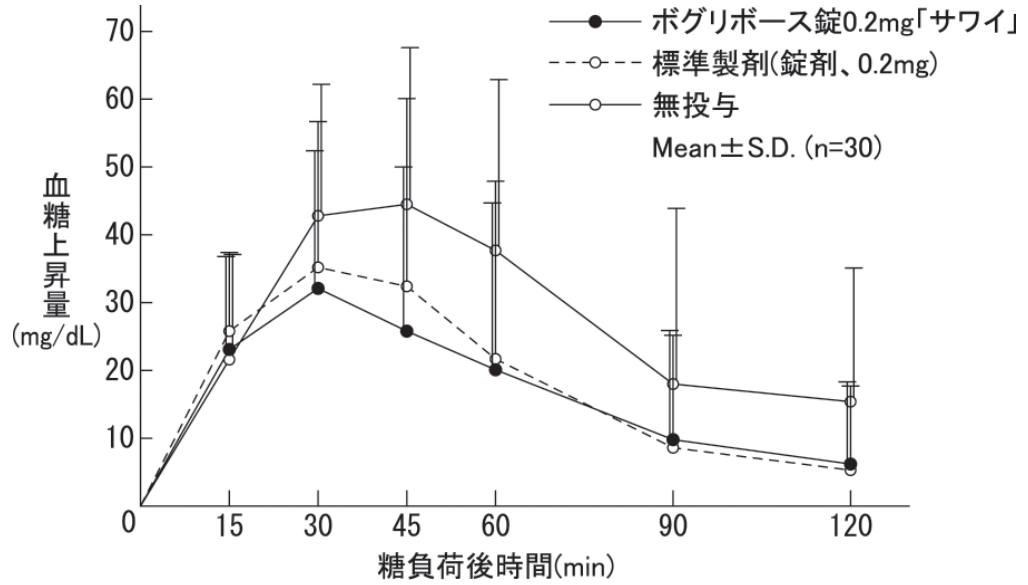
ボグリボース錠0.2mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ3錠(ボグリボースとして0.6mg)空腹時単回経口投与し、無投与群を含む3群(クロスオーバー法)に対し、ショ糖負荷(50%溶液、200mL)における血糖値の上昇量を経時的に測定した。得られたパラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

[AUC：血糖上昇量-時間曲線下面積、Cmax：最高血糖上昇量]

	製剤投与量 (ボグリボースとして)	AUC <sub>0-2hr</sub> (mg・hr/dL)	Cmax(mg/dL)
ボグリボース錠 0.2mg「サワイ」	3錠(0.6mg)	34.25±30.32	36.73±21.01
標準製剤 (錠剤、0.2mg)	3錠(0.6mg)	37.17±32.68	40.33±23.06

(Mean±S.D.)





(注)本剤の承認された1回投与量は0.3mgまでである。

●ボグリボース錠0.3mg「サワイ」<sup>15, 16)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、15、30、45、60、90、120min
休薬期間	7日間
測定方法	酵素法(Glu-DH法)

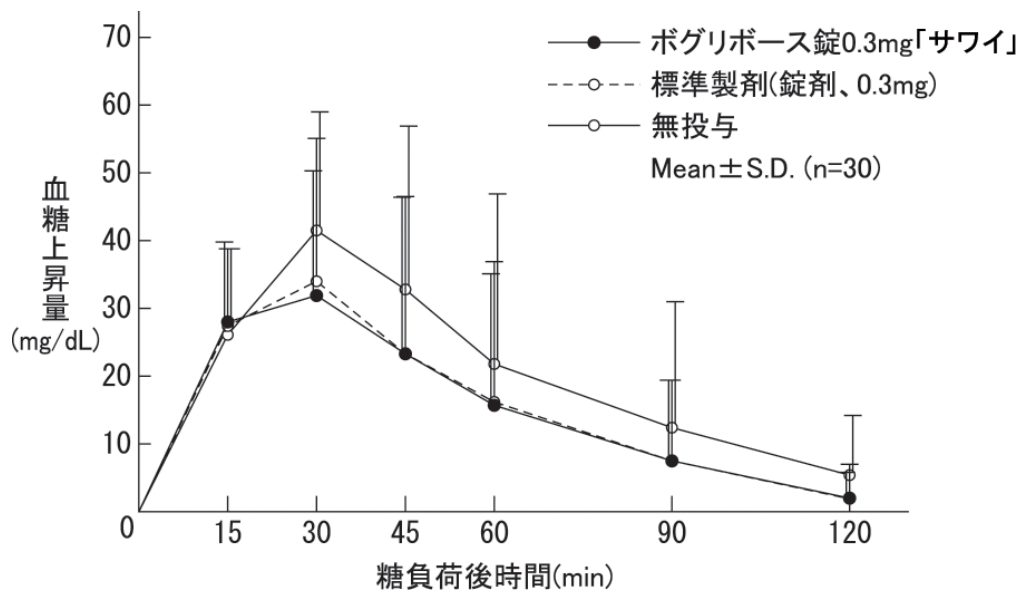
ボグリボース錠0.3mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ2錠(ボグリボースとして0.6mg)空腹時単回経口投与し、無投与群を含む3群(クロスオーバー法)に対し、ショ糖負荷(50%溶液、200mL)における血糖値の上昇量を経時的に測定した。得られたパラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

[AUC：血糖上昇量-時間曲線下面積、Cmax：最高血糖上昇量]

	製剤投与量 (ボグリボースとして)	AUC <sub>0-2hr</sub> (mg・hr/dL)	Cmax(mg/dL)
ボグリボース錠 0.3mg「サワイ」	2錠(0.6mg)	30.95 ± 23.14	36.97 ± 16.93
標準製剤 (錠剤、0.3mg)	2錠(0.6mg)	31.51 ± 24.08	40.27 ± 16.51

(Mean ± S.D.)

VI. 薬効薬理に関する項目



(注)本剤の承認された1回投与量は0.3mgまでである。  
 血糖上昇量並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

●ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」<sup>10, 17)</sup>

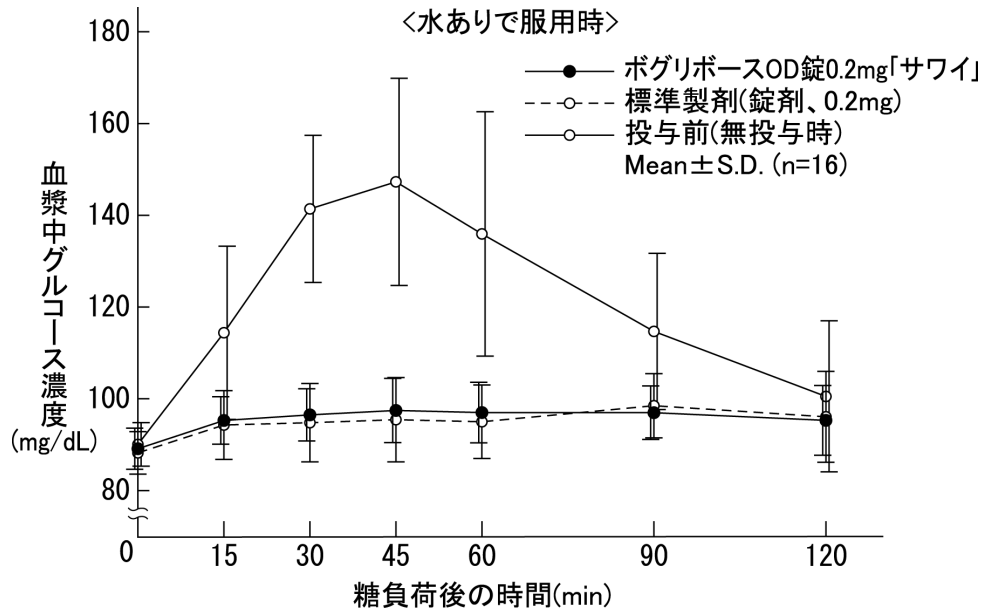
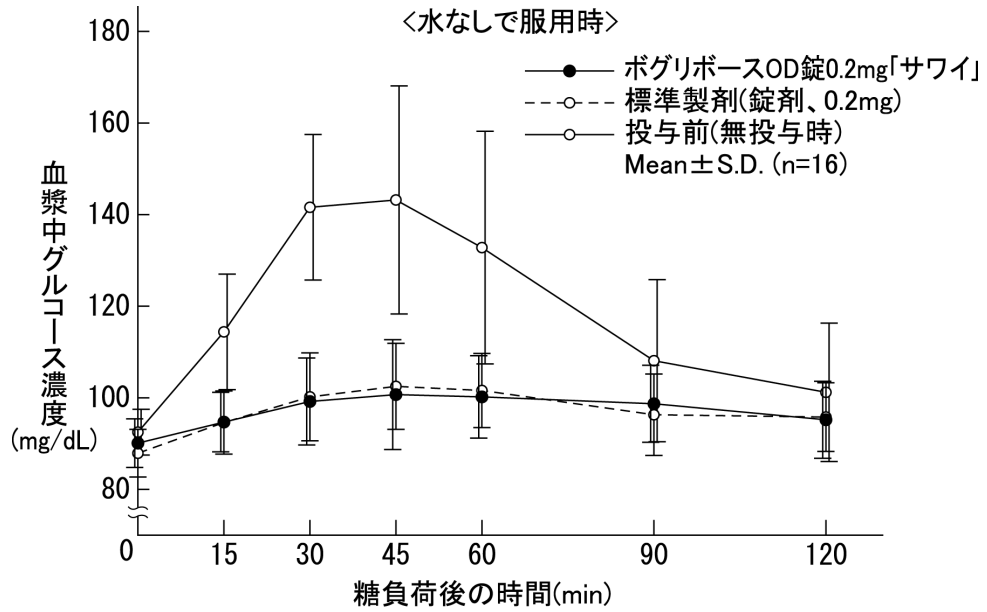
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、15、30、45、60、90、120min
休薬期間	7日間以上
測定方法	酵素法(ムロターゼ・グルコースオキシダーゼ法)

ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(ボグリボースとして0.2mg)を1日3回毎食直前にのべ4日間(9回)連続経口投与(クロスオーバー法)した。投与前及び最終投与直後にショ糖負荷(50%溶液、200mL)し経時的に血漿中グルコース濃度を測定した。得られたパラメータ(ΔAUC、ΔCmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

[ΔAUC：投与前後の血漿中グルコース濃度-時間曲線下面積の差、  
 ΔCmax：投与前後の最高血漿中グルコース濃度の差]

		ΔCmax (mg/dL)	ΔAUC <sub>0-120min</sub> (mg・min/dL)
水なし	ボグリボースOD錠0.2mg 「サワイ」	44.6 ± 18.7	2689.0 ± 1340.7
	標準製剤 (錠剤、0.2mg)	43.8 ± 21.0	2697.1 ± 1343.7
水あり	ボグリボースOD錠0.2mg 「サワイ」	50.8 ± 16.9	3238.1 ± 1355.1
	標準製剤 (錠剤、0.2mg)	50.6 ± 17.1	3315.7 ± 1279.1

(Mean ± S.D.)



●ボグリボースOD錠 0.3mg「サワイ」<sup>10, 18)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、15、30、45、60、90、120min
休薬期間	7日間以上
測定方法	酵素法(ムロターゼ・グルコースオキシダーゼ法)

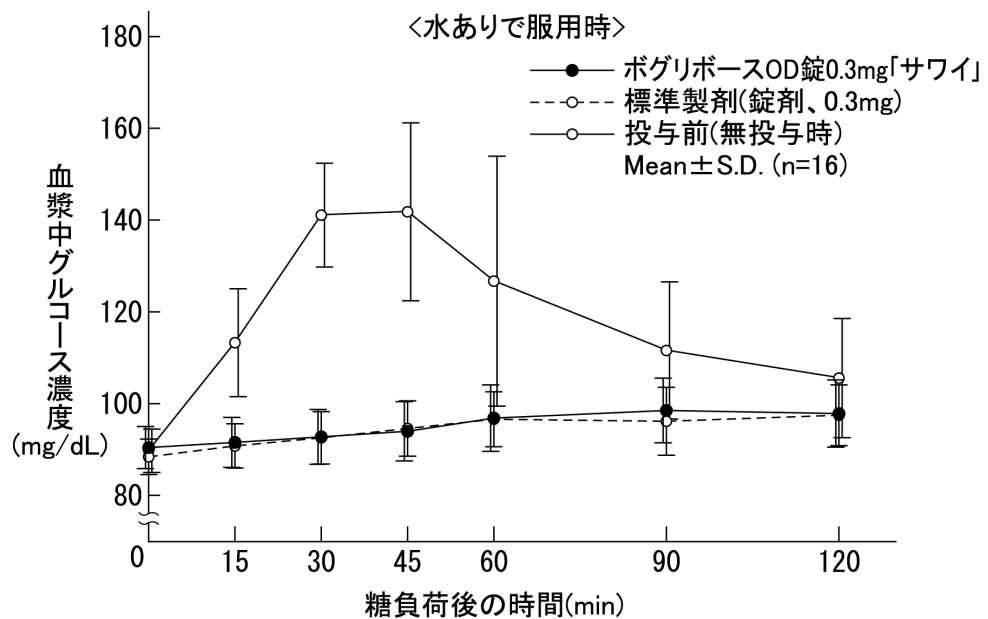
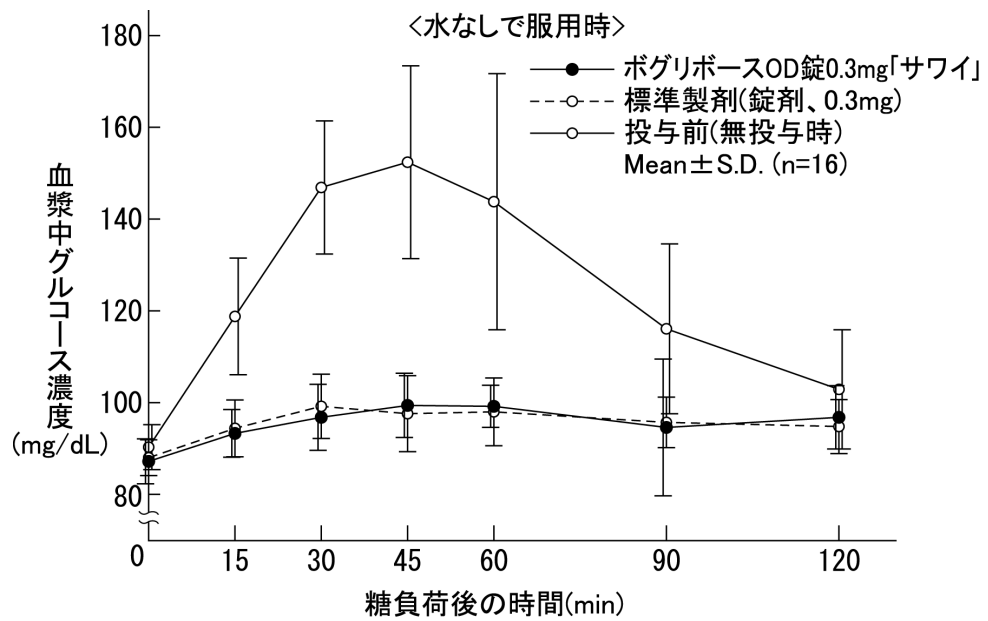
ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(ボグリボースとして0.3mg)を1日3回毎食直前にのべ4日間(9回)連続経口投与(クロスオーバー法)した。投与前及び最終投与直後にショ糖負荷(50%溶液、200mL)し経時的に血漿中グルコース濃度を測定した。得られたパラメータ( $\Delta$ AUC、 $\Delta$ Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

VI. 薬効薬理に関する項目

[ $\Delta$ AUC：投与前後の血漿中グルコース濃度-時間曲線下面積の差、  
 $\Delta$ Cmax：投与前後の最高血漿中グルコース濃度の差]

		$\Delta$ Cmax (mg/dL)	$\Delta$ AUC <sub>0-120min</sub> (mg・min/dL)
水なし	ボグリボースOD錠0.3mg 「サワイ」	53.4±19.1	3695.2±1467.9
	標準製剤 (錠剤、0.3mg)	55.5±21.0	3673.7±1513.9
水あり	ボグリボースOD錠0.3mg 「サワイ」	48.7±16.2	2939.0±1482.3
	標準製剤 (錠剤、0.3mg)	48.4±15.3	3049.8±1388.5

(Mean±S.D.)



血漿中グルコース濃度ならびに $\Delta$ AUC、 $\Delta$ Cmaxのパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

3) 作用発現時間・持続時間

VI. -2. -2) 参照

---

## VII. 薬物動態に関する項目

---

ボグリボース製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

1. 血中濃度の推移・測定法 .....
  - 1) 治療上有効な血中濃度  
ボグリボース製剤は経口投与後、ほとんど吸収されることなく、腸内で所期の作用を発揮し、糞便中より排泄される。<sup>19)</sup>
  - 2) 最高血中濃度到達時間  
通常用量では血中には検出されない。<sup>19)</sup>
  - 3) 臨床試験で確認された血中濃度  
通常用量では血中には検出されない。<sup>19)</sup>
  - 4) 中毒域  
該当資料なし
  - 5) 食事・併用薬の影響  
VIII. -7. 参照
  - 6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因  
該当資料なし
2. 薬物速度論的パラメータ .....
  - 1) 解析方法  
該当資料なし
  - 2) 吸収速度定数  
該当資料なし
  - 3) バイオアベイラビリティ  
該当資料なし
  - 4) 消失速度定数  
該当資料なし
  - 5) クリアランス  
該当資料なし

6) 分布容積

該当資料なし

7) 血漿蛋白結合率

血清タンパク結合率：10%以下<sup>1)</sup>

3. 吸収 .....

ほとんど吸収されない。<sup>19)</sup>

4. 分布 .....

1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

2) 血液-胎盤関門通過性

<参考>胎児及び乳汁中に検出されたが、いずれの時点とも母動物の血漿中濃度よりも低かった(ラット)。<sup>20)</sup>

3) 乳汁への移行性

VII. -4. -2) 参照

4) 髄液への移行性

該当資料なし

5) その他の組織への移行性

<参考>ボグリボースの<sup>14</sup>C-標識体をラットとイヌに経口投与した際の放射能の各組織への分布については、消化管壁、腎臓で比較的高い濃度を示した。<sup>20)</sup>

5. 代謝 .....

1) 代謝部位及び代謝経路

<参考><sup>14</sup>C-標識体を経口投与したラットとイヌの血漿中及び排泄物中の放射能組成を調べた結果、ボグリボースは体内ではほとんど代謝されなかった。<sup>20)</sup>

2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

該当資料なし

3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄 .....

1) 排泄部位及び経路

主にふん便中<sup>1)</sup>

2) 排泄率

1回80mgを食直前に単回経口投与したとき、48時間までの累積尿中排泄率は約1%であった。<sup>1)</sup>

(注)本剤の承認されている用法・用量はV. -2. を参照すること。

3) 排泄速度

VII. -6. -2)参照

7. トランスポーターに関する情報 .....

該当資料なし

8. 透析等による除去率 .....

該当資料なし



## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

1. 警告内容とその理由……………  
該当しない

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)……………

**【禁忌】(次の患者には投与しないこと)**

- 1) 重症ケトosis、糖尿病性昏睡又は前昏睡の患者〔輸液及びインスリンによる速やかな高血糖の是正が必須となるので本剤の投与は適さない。〕
- 2) 重症感染症、手術前後、重篤な外傷のある患者〔インスリン注射による血糖管理が望まれるので本剤の投与は適さない。〕
- 3) 本剤の成分に対する過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由……………

●ボグリボース錠0.2mg/OD錠0.2mg「サワイ」

V. -1. 参照

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由……………

●ボグリボース錠0.2mg/OD錠0.2mg/OD錠0.3mg「サワイ」

V. -2. 参照

5. 慎重投与内容とその理由……………

**慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)**

- 1) 他の糖尿病用薬を投与中の患者〔低血糖が起こることがある。〕(「重大な副作用」の項参照)
- 2) 開腹手術の既往又は腸閉塞の既往のある患者〔腸内ガス等の増加により腸閉塞が発現しやすい。〕
- 3) 消化・吸収障害を伴った慢性腸疾患の患者〔本剤の作用により病態が悪化することがある。〕
- 4) ロエムヘルド症候群、重度のヘルニア、大腸の狭窄・潰瘍等の患者〔腸内ガス等の増加により症状が悪化することがある。〕
- 5) 重篤な肝障害のある患者〔代謝状態が変化することがあるため血糖管理状況が大きく変化するおそれがある。また、重篤な肝硬変例で、高アンモニア血症が増悪し意識障害を伴うことがある。〕
- 6) 重篤な腎障害のある患者〔代謝状態が変化することがあるため血糖管理状況が大きく変化するおそれがある。〕
- 7) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

#### 重要な基本的注意

##### 全効能共通

- 1) 糖尿病の診断が確立した患者又は耐糖能異常を有する者に対してのみ適用を考慮すること。これら以外にも尿糖陽性等の類似症状を呈する疾患(腎性糖尿、老人性糖代謝異常、甲状腺機能異常、慢性膵炎等の膵臓疾患、薬剤起因性の耐糖能異常等)があることに留意すること。
- 2) 本剤の適用はあらかじめ糖尿病治療及び糖尿病発症抑制の基本である食事療法、運動療法を十分に行ったうえで効果が不十分な場合に限り考慮すること。
- 3) 本剤は低血糖症状を起こすことがあるので、糖尿病患者又は耐糖能異常を有する者に対し低血糖症状及びその対処方法について十分説明すること。また、高所作業、自動車の運転等に従事している糖尿病患者又は耐糖能異常を有する者に投与するときには注意すること。(「重大な副作用」の項参照)

##### 糖尿病の食後過血糖の改善の場合

- 1) 糖尿病治療の基本である食事療法・運動療法のみを行っている患者では、投与の際の食後血糖 2 時間値は200mg/dL以上を示す場合に限る。
- 2) 食事療法、運動療法に加えて経口血糖降下剤又はインスリン製剤を使用している患者では、投与の際の空腹時血糖値は140mg/dL以上を目安とする。
- 3) 本剤投与中は、血糖を定期的に検査するとともに、経過を十分に観察し、常に投与継続の必要性について注意を払うこと。本剤を2～3ヵ月投与しても食後血糖に対する効果が不十分な場合(静脈血漿で食後血糖 2 時間値が200mg/dL以下にコントロールできないなど)には、より適切と考えられる治療への変更を考慮すること。  
なお、食後血糖の十分なコントロール(静脈血漿で食後血糖 2 時間値が160mg/dL以下)が得られ、食事療法・運動療法又はこれらに加えて経口血糖降下剤若しくはインスリンを使用するのみで十分と判断される場合には、本剤の投与を中止して経過観察を行うこと。

##### 耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制の場合

本剤の投与開始後は、1～3ヵ月毎を目安に空腹時血糖、随時血糖、HbA1c等の糖代謝関連検査及び体重測定を実施するとともに、6～12ヵ月毎を目安に75g経口ブドウ糖負荷試験を実施して十分に経過観察し、常に投与継続の必要性に留意すること。また、血糖高値(空腹時血糖、75g経口ブドウ糖負荷試験の血糖 2 時間値)や糖負荷後初期インスリン分泌低下等を有する場合には、糖尿病発症リスクが高くなるとの報告があるので、十分な観察を行うこと。

なお、2型糖尿病と診断された場合には、適切と考えられる治療への変更を考慮すること。また、本剤投与開始後に耐糖能異常が改善し、食事療法・運動療法のみで十分と判断される場合には、本剤の投与を中止して糖代謝関連検査等による経過観察を行うこと。

### 7. 相互作用

#### 1) 併用禁忌とその理由

該当しない



VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

3) その他の副作用

2) その他の副作用	
	頻度不明
消化器	下痢、放屁、腹部膨満、軟便、腹鳴、腹痛、便秘、食欲不振、悪心、嘔吐、胸やけ、口渇、口内炎、味覚異常、腸管嚢胞様気腫症
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹、そう痒、光線過敏症
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、LDH、 $\gamma$ -GTP、Al-Pの上昇
精神神経系	めまい、頭痛、ふらつき、眠気
血液	貧血、血小板減少、顆粒球減少
その他	しびれ、顔面等の浮腫、眼のかすみ、ほてり、倦怠感、脱力感、高カリウム血症、血清アミラーゼ上昇、HDLコレステロール低下、発汗、脱毛

注)このような場合には投与を中止すること。

4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

ボグリボース製剤の副作用が以下のとおり報告されている。

主な副作用は放屁増加3.32%、下痢2.09%、腹部膨満感1.83%、腹部膨満1.70%、血清ALT(GPT)上昇1.47%等であった。<sup>21)</sup>

5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

**【禁忌】(次の患者には投与しないこと)**

3) 本剤の成分に対する過敏症の既往歴のある患者

2) その他の副作用	
	頻度不明
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹、そう痒、光線過敏症

注)このような場合には投与を中止すること。

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため、低用量(例えば1回量0.1mg)から投与を開始するとともに、血糖値及び消化器症状の発現に留意するなど、経過を十分に観察しながら慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- 2) 授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。〔動物試験(ラット)で、母動物の糖質吸収の抑制に起因する乳汁産生の抑制によると考えられる出生児の体重の増加抑制が認められている。〕

11. 小児等への投与 .....

小児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....

該当資料なし

13. 過量投与 .....

該当資料なし

14. 適用上の注意 .....

1) 薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。  
(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦  
隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)  
[OD錠0.2mg/OD錠0.3mgのみ]  
2) 服用時：本剤は舌の上へのせ唾液を浸潤させ舌で軽くつぶし、崩壊後唾液のみで服用可  
能である。また、水で服用することもできる。

15. その他の注意 .....

該当しない

16. その他 .....

---

## IX. 非臨床試験に関する項目

---

ボグリボースの非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

### 1. 薬理試験

#### 1) 薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)

#### 2) 副次的薬理試験

該当資料なし

#### 3) 安全性薬理試験

消化管系の試験は経口投与により、またボグリボースは消化管よりほとんど吸収されないため静脈内投与によっても検討されたが、特記すべき作用を示さなかった。<sup>20)</sup>

#### 4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

#### 1) 単回投与毒性試験

LD <sub>50</sub> (g/kg) <sup>20)</sup>	
動物種	経口
マウス	>14
ラット	約20

#### 2) 反復投与毒性試験

##### 亜急性毒性試験及び慢性毒性試験

ラットにおける無影響量は、5週間、13週間及び1年間強制経口投与した場合、それぞれ30mg/kg/日、10mg/kg/日未満及び3mg/kg/日であった。また、イヌにおける無影響量は、4週間、13週間及び1年間強制投与試験で、それぞれ300mg/kg/日、30mg/kg/日未満及び10mg/kg/日であった。<sup>20)</sup>

#### 3) 生殖発生毒性試験

##### 1) ラット Seg. I 試験

ボグリボースの10、30、100mg/kgの経口投与で行われた結果、親動物、胚・出生児に対する無影響量はいずれも30mg/kg/日と推定された。<sup>20)</sup>

##### 2) ラット Seg. II 試験

100、300、900mg/kgの経口投与で行われた結果、親動物、胎児、出生児に対する無影響量はいずれも100mg/kg/日と推定された。<sup>20)</sup>

##### 3) ウサギ Seg. II 試験

100、300、1,000mg/kgの経口投与で行われた結果、親動物及び胎児に対する無影響量はいずれも100mg/kg/日と推定された。<sup>20)</sup>

**4) ラット Seg. III 試験**

30、100、300mg/kgの経口投与で行われた結果、親動物及び出生児に対する無影響量はいずれも30mg/kg/日と推定された。<sup>20)</sup>

5) Seg. I 及び Seg. III 試験で出生児の生存率の低下及び体重増加の抑制が認められたため、グルコース食給餌下で300mg/kg/日を強制経口投与し、母動物及び出生児の発育に及ぼす影響の検討が行われた結果、ボグリボースの直接的な毒性ではなく、薬効による母動物の低栄養状態に起因する変化と推定された。<sup>20)</sup>

**4) その他の特殊毒性**

**1) 抗原性試験**

モルモットで経口及び皮内、マウスで経口及び皮下投与試験が実施されたが、いずれにも陰性であった。<sup>20)</sup>

**2) 変異原性試験**

復帰変異試験、染色体異常試験及び小核試験が実施されたが、いずれも陰性であった。<sup>20)</sup>

**3) 癌原性試験**

マウス及びラットにおける24ヵ月間強制経口投与試験が実施されたが、いずれにもボグリボースの投与に起因したと考えられる腫瘍の発生は認められなかった。<sup>20)</sup>

**X. 管理的事項に関する項目**

1. 規制区分

規制区分	
製剤	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	該当しない

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

3. 貯法・保存条件

- ボグリボース錠0.2mg/錠0.3mg「サワイ」

室温保存

- ボグリボースOD錠0.2mg/OD錠0.3mg「サワイ」

室温保存

開封後は高温・高湿を避けて保存すること

4. 薬剤取扱い上の注意点

1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

VIII. -6. 及びVIII. -14. 参照

ボグリボースOD錠「サワイ」を服用される患者さんへ

<ボグリボース錠「サワイ」>      <ボグリボースOD錠「サワイ」>

表裏	表裏	表裏	表裏
SV	0.2	SV	0.3
0.2	0.3	0.2	0.3

OD錠：水なしでものめるタイプの錠剤

**食後の過血糖(食後の急激な血糖の上昇)を改善する糖尿病の薬が処方されています。以下の点にご注意ください。**

(1) この薬は食事の直前にお飲みください。  
ごはんやパン等の食べ物と混ぜられて効く薬ですので、**食事の直前**にお飲みください。飲み忘れた場合は、次の食事の直前に1回分を飲んでください。絶対に2回分を一度に飲んではいけません。

(2) 低血糖症状を起こすことがあります。  
この薬とほかの糖尿病の薬(血糖を下げる薬)を併用した場合は、低血糖を起こすことがあります。  
また、ほかの糖尿病の薬を併用していない場合でも、低血糖を起こすことがあります。  
この薬は砂糖の消化や吸収を遅らせます。ほかの糖尿病の薬による低血糖症状に効果のある砂糖は、この薬をお飲みの時は**不適切**です。必ず**ブドウ糖**をお飲みください。この注意は必ず家族やまわりの方にも知らせておいてください。  
高所作業や自動車の運転等危険を伴う機械を操作している時に、低血糖症状を起こすと事故につながります。特に注意してください。

(3) 不快な症状が気になる場合は主治医に相談してください。

(裏面にもご覧ください。)

**低血糖症状について**

●低血糖症状とは  
血液中の糖分が少なくなりすぎた状態で、急に強い異常な空腹感、力のぬけた感じ、発汗、手足のふるえ、眼のちらつき等が起こったり、また頭が痛かったり、ぼんやりしたり、ふらふらしたり、いつもと人柄の違ったような異常な行動をとることもあります。  
はなはだしい場合には、けいれんを起こしたり意識を失うこともあります。

脱力感・異常な空腹感      冷汗・動悸      手足のふるえ      頭痛・頭が重いめまい      意識を失う

●低血糖症状が起こったら  
・空腹時に起こり、食べ物をとると急に良くなるのが特徴です。  
・低血糖症状がもし起こったら危険な状態ですから、軽いうちに治してしまわなければなりません。軽いうちはブドウ糖をとると治ります。平素から**10~15gのブドウ糖**を持ち歩き、すぐその場でブドウ糖をとることが必要です。  
・低血糖症状を起こした場合は、必ず早めに主治医に報告してください。

●低血糖症状を起こさないために  
・低血糖症状を予防するためには、薬の量や飲み方は主治医の指導を守り、また食事療法・運動療法はきちんと守ることが大切です。  
・食事時刻の遅れ、激しい運動、空腹時の運動は避けるようにしましょう。

GU529101PV02 2015年1月13日

注) 当説明書は変更・改訂される場合があります。



3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

●ボグリボース錠0.2mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)、1,000錠(10錠×100)、1,050錠(21錠×50)

バラ：500錠

●ボグリボース錠0.3mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)、1,000錠(10錠×100)、1,050錠(21錠×50)

バラ：500錠

●ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)、1,000錠(10錠×100)、1,050錠(21錠×50)

●ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)、1,000錠(10錠×100)、1,050錠(21錠×50)

7. 容器の材質

●ボグリボース錠0.2mg/錠0.3mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔

[ピロー]ポリエチレンフィルム

バラ：ポリエチレン袋

●ボグリボースOD錠0.2mg/OD錠0.3mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ベイスン錠0.2/錠0.3/OD錠0.2/OD錠0.3

同効薬：α-グルコシダーゼ阻害剤：アカルボース、ミグリトール

9. 国際誕生年月日

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

●ボグリボース錠0.2mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2011年2月15日(販売名変更)、承認番号：22300AMX00474000

ボグリボース錠0.2mg「SW」(旧販売名)

製造販売承認年月日：2005年3月3日、承認番号：21700AMZ00285000

●ボグリボース錠0.3mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2011年2月15日(販売名変更)、承認番号：22300AMX00475000

ボグリボース錠0.3mg「SW」(旧販売名)

製造販売承認年月日：2005年3月3日、承認番号：21700AMZ00284000

●ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2007年3月15日、承認番号：21900AMX00372000

●ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2007年3月15日、承認番号：21900AMX00373000

11. 薬価基準収載年月日

●ボグリボース錠0.2mg「サワイ」：2011年11月28日(販売名変更)

ボグリボース錠0.2mg「SW」(旧販売名)：2005年7月8日

経過措置期間終了：2013年3月31日

●ボグリボース錠0.3mg「サワイ」：2011年11月28日(販売名変更)

ボグリボース錠0.3mg「SW」(旧販売名)：2005年7月8日

経過措置期間終了：2013年3月31日

●ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」：2007年7月6日

●ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」：2007年7月6日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

●ボグリボース錠0.2mg/OD錠0.2mg「サワイ」

承認年月日：2014年4月1日

効能・効果内容：「耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制」の効能・効果を追加した。

用法・用量内容：効能・効果追加に伴い、関連の用法・用量を追加した。

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

## 16. 各種コード .....

品名	HOT番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
ボグリボース錠0.2mg「サワイ」	116912601	3969004F1268	621691201
ボグリボース錠0.3mg「サワイ」	116916401	3969004F2264	621691601
ボグリボースOD錠0.2mg「サワイ」	118034301	3969004F3066	620005559
ボグリボースOD錠0.3mg「サワイ」	118038101	3969004F4062	620005564

## 17. 保険給付上の注意 .....

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制(ただし、食事療法及び運動療法を十分に行っても改善されない場合に限る。)を目的に使用する場合、保険適用上の取扱いを以下のとおりとすること。

- 1) 耐糖能異常(空腹時血糖が126mg/dL未満かつ75g経口ブドウ糖負荷試験の血糖2時間値が140～199mg/dL)と判断され、糖尿病発症抑制の基本である食事療法及び運動療法を3～6ヵ月間行っても改善されず、かつ高血圧症、脂質異常症(高トリグリセリド血症、低HDLコレステロール血症等)のいずれかを基礎疾患として有する患者を対象とする場合に限り、保険適用されるものとする。
- 2) 診療報酬明細書の摘要欄には、耐糖能異常と判断した根拠(判断した年月日とその結果)、食事療法及び運動療法を3～6ヵ月間行っても改善されなかった旨及び高血圧症又は脂質異常症の診断名を記載する。

---

## XI . 文 献

---

### 1. 引用文献 .....

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編, 第十七改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2016, C-5141 - C-5146.
- 2) 貴田岡正史他, 薬理と治療, **34**(5), 499(2006).
- 3) 吉田昌則他, 医学と薬学, **59**(2), 213(2008).
- 4) ~ 7) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]
- 8) ~ 9) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
- 10) 陶 易王他, 医学と薬学, **57**(5), 651(2007).
- 11) ~ 12) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
- 13) 陶 易王他, 医学と薬学, **53**(6), 779(2005).
- 14) 沢井製薬(株) 社内資料[薬力学的試験]
- 15) 川島 亨他, 医学と薬学, **53**(6), 785(2005).
- 16) ~ 18) 沢井製薬(株) 社内資料[薬力学的試験]
- 19) 厚生省医薬安全局安全対策課監修, 医師・歯科医師・薬剤師のための医薬品服薬指導情報集16, じほう, 1998, p. 121-130.
- 20) 月刊薬事, **37**(2), 460(1995).
- 21) 梅田悦生, 常用医薬品の副作用 - 禁忌・慎重投与・相互作用への対応, 改訂第2版, 南江堂, 1999, p. 323-325.

### 2. その他の参考文献 .....

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....

2. 海外における臨床支援情報 .....

該当資料なし

---

## XIII. 備考

---

その他の関連資料 .....





