

## 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2018(2019年更新版)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

**ベイスン<sup>®</sup>錠 0.2・0.3**  
*BASEN<sup>®</sup>Tablets*

日本薬局方 ボグリボース口腔内崩壊錠

**ベイスン<sup>®</sup>OD錠 0.2・0.3**  
*BASEN<sup>®</sup>ODTablets*

剤形	錠：素錠 OD錠：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：1錠中ボグリボース0.2mg及び0.3mg含有 OD錠：1錠中ボグリボース0.2mg及び0.3mg含有
一般名	和名：ボグリボース(JAN) 洋名：Voglibose(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・販売開始年月日	錠0.2及び0.3 製造販売承認年月日：1994年7月1日 2004年2月25日 薬価基準収載年月日：1994年8月26日 2004年7月9日 販売開始年月日：1994年9月6日 2004年7月14日
製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：武田テバ薬品株式会社 販 売：武田薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	武田テバ薬品株式会社 武田テバDIセンター TEL 0120-923-093 受付時間 9:00～17:30(土日祝日・弊社休業日を除く) 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.med.takeda-teva.com">https://www.med.takeda-teva.com</a>

本IFは2023年1月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

# 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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IF と略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

### 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

# 目 次

---

## I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的特性	1
3. 製品の製剤学的特性	2
4. 適正使用に関して周知すべき特性	2
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2
(1) 承認条件	2
(2) 流通・使用上の制限事項	2
6. RMP の概要	2

## II. 名称に関する項目

1. 販売名	3
(1) 和名	3
(2) 洋名	3
(3) 名称の由来	3
2. 一般名	3
(1) 和名 (命名法)	3
(2) 洋名 (命名法)	3
(3) ステム (stem)	3
3. 構造式又は示性式	3
4. 分子式及び分子量	4
5. 化学名 (命名法) 又は本質	4
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4

## III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質	5
(1) 外観・性状	5
(2) 溶解性	5
(3) 吸湿性	5
(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点	5
(5) 酸塩基解離定数	5
(6) 分配係数	6
(7) その他の主な示性値	6
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6
3. 有効成分の確認試験法、定量法	6

## IV. 製剤に関する項目

1. 剤形	7
(1) 剤形の区別	7
(2) 製剤の外観及び性状	7
(3) 識別コード	7
(4) 製剤の物性	7
(5) その他	7
2. 製剤の組成	8
(1) 有効成分 (活性成分) の含量及び添加剤	8
(2) 電解質等の濃度	8
(3) 熱量	8
3. 添付溶解液の組成及び容量	8
4. 力価	8

5. 混入する可能性のある夾雑物	8
6. 製剤の各種条件下における安定性	9
7. 調製法及び溶解後の安定性	12
8. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)	12
9. 溶出性	12
10. 容器・包装	12
(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報	12
(2) 包装	12
(3) 予備容量	12
(4) 容器の材質	13
11. 別途提供される資材類	13
12. その他	13

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	14
2. 効能又は効果に関連する注意	14
3. 用法及び用量	14
(1) 用法及び用量の解説	14
(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	15
4. 用法及び用量に関連する注意	15
5. 臨床成績	15
(1) 臨床データパッケージ	15
(2) 臨床薬理試験	15
(3) 用量反応探索試験	16
(4) 検証的試験	18
(5) 患者・病態別試験	22
(6) 治療的使用	23
(7) その他	25

## 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	26
2. 薬理作用	26
(1) 作用部位・作用機序	26
(2) 薬効を裏付ける試験成績	26
(3) 作用発現時間・持続時間	34

## VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移	35
(1) 治療上有効な血中濃度	35
(2) 臨床試験で確認された血中濃度	35
(3) 中毒域	37
(4) 食事・併用薬の影響	37
2. 薬物速度論的パラメータ	37
(1) 解析方法	37
(2) 吸収速度定数	37
(3) 消失速度定数	37
(4) クリアランス	37
(5) 分布容積	37
(6) その他	37

3. 母集団（ポピュレーション）解析	37
(1) 解析方法	37
(2) パラメータ変動要因	37
4. 吸収	37
5. 分布	38
(1) 血液－脳関門通過性	38
(2) 血液－胎盤関門通過性	38
(3) 乳汁への移行性	38
(4) 髄液への移行性	38
(5) その他の組織への移行性	39
(6) 血漿蛋白結合率	40
6. 代謝	40
(1) 代謝部位及び代謝経路	40
(2) 代謝に關与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率	40
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	40
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	40
7. 排泄	40
8. トランスポーターに関する情報	42
9. 透析等による除去率	42
10. 特定の背景を有する患者	42
11. その他	42

## 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	43
2. 禁忌内容とその理由	43
3. 効能又は効果に關連する注意とその理由	43
4. 用法及び用量に關連する注意とその理由	43
5. 重要な基本的注意とその理由	43
6. 特定の背景を有する患者に關する注意	44
(1) 合併症・既往歴等のある患者	44
(2) 腎機能障害患者	44
(3) 肝機能障害患者	44
(4) 生殖能を有する者	44
(5) 妊婦	44
(6) 授乳婦	45
(7) 小児等	45
(8) 高齢者	45
7. 相互作用	45
(1) 併用禁忌とその理由	45
(2) 併用注意とその理由	46
8. 副作用	47
(1) 重大な副作用と初期症状	47
(2) その他の副作用	47
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	51
10. 過量投与	51
11. 適用上の注意	51
12. その他の注意	52
(1) 臨床使用に基づく情報	52
(2) 非臨床試験に基づく情報	52

## IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	53
(1) 薬効薬理試験	53
(2) 安全性薬理試験	53
(3) その他の薬理試験	53
2. 毒性試験	54
(1) 単回投与毒性試験	54
(2) 反復投与毒性試験	54
(3) 遺伝毒性試験	54
(4) がん原性試験	54
(5) 生殖発生毒性試験	55
(6) 局所刺激性試験	55
(7) その他の特殊毒性	55

## X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	56
2. 有効期間	56
3. 包装状態での貯法	56
4. 取扱い上の注意	56
5. 患者向け資材	56
6. 同一成分・同効薬	57
7. 国際誕生年月日	57
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	57
9. 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	57
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	57
11. 再審査期間	57
12. 投薬期間制限に関する情報	57
13. 各種コード	58
14. 保険給付上の注意	58

## XI. 文献

1. 引用文献	59
2. その他の参考文献	59

## XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	60
2. 海外における臨床支援情報	60

## XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	61
(1) 粉碎	61
(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	61
2. その他の関連資料	61

## I：概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

---

二糖類水解酵素（ $\alpha$ -グルコシダーゼ）に対し $\alpha$ -アミラーゼより強い阻害作用を示す疑似アミノ糖「バリエナミン」の単離に成功した武田薬品工業株式会社では、さらに特異的な阻害薬の探索研究を行い、バリエナミンよりも強い $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害活性を示す新規疑似アミノ糖「バリオールアミン」を1981年に発見した。本化合物の誘導体について阻害活性、安全性、安定性等を検討した結果、これらの点で最も優れた化合物としてボグリボースが選定された。ボグリボースは、糖尿病用薬として開発され、1985年より着手された臨床試験において、単剤、スルホニルウレア系薬剤及びインスリン製剤との併用において食後の過血糖を改善することが確認された。

本剤は、 $\alpha$ -グルコシダーゼを選択的に阻害することにより糖質の消化・吸収を遅延させ、糖尿病にみられる食後の過血糖を改善する経口糖尿病用薬として、1994年7月に承認を受けた。

その後、水なしでも服用可能な口腔内崩壊錠も2004年2月に承認を受けた。

また製造販売後の調査・試験の成績を基に再審査を受け、有用性が確認された（2004年9月公表）。更に、2型糖尿病の発症リスクが高い耐糖能異常を有する者を対象とした臨床試験において、2型糖尿病の発症抑制効果が確認されたことから、耐糖能異常<sup>\*</sup>における2型糖尿病の発症を抑制する薬剤として2009年10月に承認を受けた。

2016年10月に武田テバ薬品株式会社が武田薬品工業株式会社より製造販売承認を承継した。

2017年3月には耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制について再審査結果が公表され有用性が再確認された。

※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. 製品の治療学的特性

---

- (1) 糖質の消化・吸収を遅延させることにより食後の過血糖を改善する経口糖尿病用薬である。（「VI.2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照）
- (2) 糖尿病の基礎治療である食事療法・運動療法で効果不十分な場合<sup>注1)</sup>ばかりでなく、経口血糖降下剤、インスリン製剤で効果不十分な場合<sup>注2)</sup>にも使用できる。（「V.5. 臨床成績」の項参照）
- (3) 食後過血糖の改善はHbA1cにも反映される。（「VI.2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照）
- (4) 2型糖尿病の発症リスクの高い耐糖能異常を有する者で2型糖尿病発症抑制<sup>注3)</sup>が認められている。（錠0.2、OD錠0.2のみ）（「V.5. 臨床成績」の項参照）

- (5) 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、意識障害を伴う高アンモニア血症が報告されている。〔Ⅷ. 8. (1) 重大な副作用と初期症状〕の項参照)

- 注1) 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。
- 注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。
- 注3) 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 ヶ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。

### 3. 製品の製剤学的特性

OD 錠は、水なしで服用可能な口腔内崩壊錠である。

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、 最適使用推進ガイドライン等	有無	内容
RMP（医薬品リスク管理計画）	無	—
追加のリスク最小化活動として 作成されている資料	無	—
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	有	・ベイスン OD 錠 0.2 及びベイスン錠 0.2 並びにレベトールカプセル 200mg の薬事法上の効能・効果等の変更に伴う留意事項の一部改正について（平成 21 年 10 月 16 日付、保医発 1016 第 3 号） 〔X. 14. 保険給付上の注意〕の項参照)

(2021 年 4 月時点)

### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

#### (1) 承認条件

該当しない

#### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

### 6. RMP の概要

該当しない

## Ⅱ：名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

ベイスン<sup>®</sup>錠 0.2

ベイスン<sup>®</sup>錠 0.3

ベイスン<sup>®</sup> OD 錠 0.2

ベイスン<sup>®</sup> OD 錠 0.3

#### (2) 洋名

BASEN<sup>®</sup> Tablets 0.2

BASEN<sup>®</sup> Tablets 0.3

BASEN<sup>®</sup> OD Tablets 0.2

BASEN<sup>®</sup> OD Tablets 0.3

#### (3) 名称の由来

◇ベイスン：常に継続すべき糖尿病の基礎治療である食事療法の効果を高めることから、糖尿病の basic therapy の一環として有用性が期待できる薬剤である点を表現した。

◇OD錠：Orally Dispersing Tablets

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

ボグリボース (JAN)

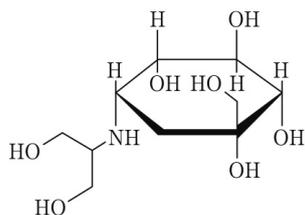
#### (2) 洋名 (命名法)

Voglibose (JAN)

#### (3) ステム (stem)

抗高血糖薬：gli

### 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）又は本質

---

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

---

開発コード：AO-128

### 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。

(日本薬局方)

##### (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。

(日本薬局方)

##### ■各種溶媒に対する溶解性

溶媒名	本品1gを溶かすのに要する溶媒量（mL）	溶解性の表現
水	<1	極めて溶けやすい
酢酸（100）	2.0～2.5	溶けやすい
メタノール	240～270	溶けにくい
エタノール（99.5）	2,400～3,000	極めて溶けにくい
ジエチルエーテル	>10,000	ほとんど溶けない

日局：通則による

(武田薬品・研究所)

##### (3) 吸湿性

25℃・75% RH 及び 84% RH の条件下で7日間保存したとき、吸湿性は認められなかった。

25℃・93% RH の条件下では、7日間で7%の吸湿が認められた。

(武田薬品・研究所)

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：163～168℃

(日本薬局方)

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa：7.06（イミノ基、25℃）

(武田薬品・研究所)

## (6) 分配係数

本品は水系溶媒の pH とは無関係に、有機溶媒にはほとんど分配されない。

### ■本品の分配係数 (25°C)

水溶液のpH	エーテル	酢酸エチル	オクタノール
水	0.01以下	0.01以下	0.01以下
0.1mol/L塩酸	0.01以下	0.01以下	—
0.1mol/L水酸化ナトリウム	0.01以下	—	—

分配係数：有機相中の濃度/水相中の濃度、—：測定せず

(武田薬品・研究所)

## (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。

(日本薬局方)

## 2. 有効成分の各種条件下における安定性

	保存条件	保存形態	保存期間	結 果			
				外 観	水 分	含 量	
長期保 存試験	室温、暗所	無色ガラス瓶 (密栓)	39カ月	変化なし	変化なし	変化なし	
苛 酷 試 験	40°C、暗所	無色ガラス瓶 (密栓)	12カ月	変化なし	変化なし	変化なし	
	50°C、暗所		9カ月	変化なし	変化なし	変化なし	
	60°C、暗所		6カ月	白色~帯黄白色	変化なし	変化なし	
	湿 度	25°C、75%RH、暗所	無色ガラス瓶 (開栓)	12カ月	白色~帯黄白色	変化なし	変化なし
		40°C、75%RH、暗所		6カ月	白色~帯黄白色	変化なし	変化なし
	光	白色蛍光灯(1,000lx)	シャーレ (ポリ塩化ビニリデン 製フィルムで覆う)	40日間	変化なし	変化なし	変化なし
キセノンランプ(25,000lx)		200時間		変化なし	変化なし	変化なし	

(武田薬品・研究所)

## 3. 有効成分の確認試験法、定量法

### 確認試験法

日局「ボグリボース」確認試験による。

### 定量法

日局「ボグリボース」定量法による。

## IV：製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

ベイスン錠：素錠

ベイスン OD 錠：素錠（口腔内崩壊錠）

#### (2) 製剤の外観及び性状

##### ■ベイスン錠

販 売 名	ベイスン錠 0.2	ベイスン錠 0.3
色 ・ 剤 形	白色～帯黄白色の割線入り素錠	白色～帯黄白色の素錠
形 状		
直 径 (mm)	7.1	8.1
厚 さ (mm)	2.6	3.1
重 量 (mg)	130	200

##### ■ベイスン OD 錠

販 売 名	ベイスンOD錠 0.2	ベイスンOD錠 0.3
色 ・ 剤 形	帯黄白色の割線入り口腔内崩壊錠	微黄色の口腔内崩壊錠
形 状		
直 径 (mm)	7.6	8.6
厚 さ (mm)	2.7	3.2
重 量 (mg)	150	220

#### (3) 識別コード

ベイスン錠0.2：⊕351

ベイスン錠0.3：⊕352

ベイスンOD錠0.2：⊕341

ベイスンOD錠0.3：⊕342

#### (4) 製剤の物性

該当資料なし

#### (5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

■ベイスン錠

販売名	ベイスン錠 0.2	ベイスン錠 0.3
有効成分	1錠中：ボグリボース 0.2mg	1錠中：ボグリボース 0.3mg
添加剤	トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、乳糖水和物	

■ベイスン OD 錠

販売名	ベイスン OD 錠 0.2	ベイスン OD 錠 0.3
有効成分	1錠中：ボグリボース 0.2mg	1錠中：ボグリボース 0.3mg
添加剤	ヒドロキシプロピルセルロース、黄色三二酸化鉄、トウモロコシデンプン、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、結晶セルロース、クロスポビドン、ステアリン酸マグネシウム、D-マンニトール	

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

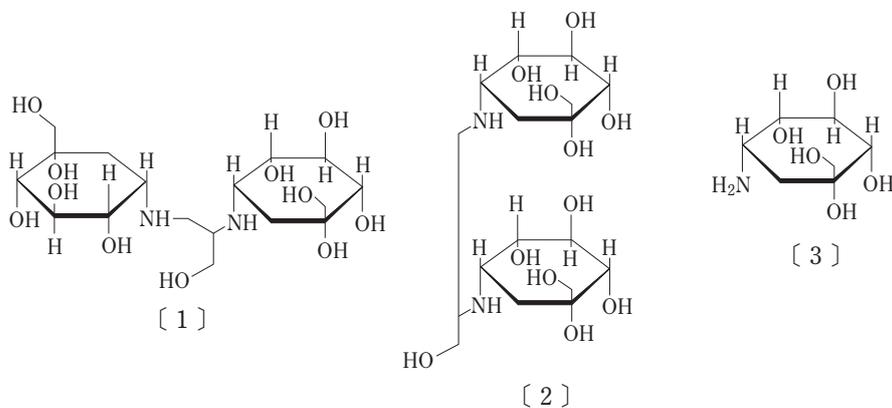
該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

次の3種類の類縁物質がわずかに混入する可能性がある。



(第十八改正日本薬局方解説書 2021, C-5392 廣川書店)

## 6. 製剤の各種条件下における安定性

### (1) 長期保存試験 (保存条件：25℃±2℃、60%RH±5%)

#### 1) バイスン錠0.2 (保存形態：PTP+内袋+紙箱)

平均

測定項目	イニシャル	12カ月	24カ月	36カ月
外 観	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし	変化なし
溶 出 性	適合	適合	適合	適合
含 量 ( % )	101.5	99.8	100.2	99.1

#### 2) バイスン錠0.3 (保存形態：PTP+内袋+紙箱)

平均

測定項目	イニシャル	12カ月	24カ月	36カ月
外 観	白色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし
溶 出 性	適合	適合	適合	適合
含 量 ( % )	100.0	99.6	99.4	99.4

(武田テバ薬品)

#### 3) バイスンOD錠0.2 (保存形態：PTP+内袋+紙箱)

平均

測定項目	イニシャル	12カ月	24カ月	36カ月
外 観	帯黄白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし	変化なし
溶 出 性	適合	適合	適合	適合
含 量 ( % )	100.9	99.1	100.1	100.5

#### 4) バイスンOD錠0.3 (保存形態：PTP+内袋+紙箱)

平均

測定項目	イニシャル	12カ月	24カ月	36カ月
外 観	微黄色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし
溶 出 性	適合	適合	適合	適合
含 量 ( % )	100.8	99.9	100.9	100.3

(武田テバ薬品)

### (2) 苛酷試験

#### 1) 熱安定性 (保存形態：無色ガラス瓶、密栓)

バイスン錠0.2 (保存条件：40℃)

3ロット平均

測定項目	イニシャル	2カ月	4カ月	6カ月
外 観	白色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊時間(分)	8.8	8.9	9.1	9.0
残 存 率 (%)	100	99.9	99.4	99.8

バイスン錠0.2 (保存条件：50℃)

3ロット平均

測定項目	イニシャル	1カ月	2カ月	3カ月
外 観	白色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊時間(分)	8.8	9.5	9.0	9.1
残 存 率 (%)	100	99.8	99.3	99.1

(武田薬品・研究所)

バイスンOD錠0.2 (保存条件：50℃)

1ロット

測定項目	イニシャル	1カ月	2カ月	3カ月
外観	帯黄白色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	適合	適合	適合	適合
残存率(%)	100	99.9	99.3	97.8

バイスンOD錠0.3 (保存条件：50℃)

1ロット

測定項目	イニシャル	1カ月	2カ月	3カ月
外観	微黄色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	適合	適合	適合	適合
残存率(%)	100	101.0	100.4	98.3

(武田薬品・研究所)

2) 湿度安定性 (保存形態：無色ガラス瓶、開栓)

バイスン錠0.2 (保存条件：25℃、75%RH)

3ロット平均

測定項目	イニシャル	2カ月	4カ月	6カ月
外観	白色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊時間(分)	8.8	8.2	8.2	8.9
残存率(%)	100	99.8	100.3	99.8

バイスン錠0.2 (保存条件：40℃、75%RH)

3ロット平均

測定項目	イニシャル	2カ月	4カ月	6カ月
外観	白色の錠剤	変化なし	変化なし	帯黄白色の錠剤
崩壊時間(分)	8.8	8.3	8.8	8.8
残存率(%)	100	99.7	99.8	99.4

(武田薬品・研究所)

バイスンOD錠0.2及びOD錠0.3

保存条件：25℃、93%RH、保存形態：無色ガラス瓶、開栓

1カ月の保存で溶出遅延、硬度低下及び乾燥減量の増加が認められた。

(武田薬品・研究所)

注) OD錠は、開封後も湿気を避けて保存すること。本品は高防湿性の内袋により品質保持をはかっている。

3) 光安定性 (保存形態：シャーレ、ポリ塩化ビニリデン製のフィルムで覆う)

バイスン錠0.2 (保存条件：白色蛍光灯、1,000lx)

3ロット平均

測定項目	イニシャル	10日	25日	40日
外観	白色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊時間(分)	8.8	8.9	8.3	8.4
残存率(%)	100	100.0	99.8	100.4

(武田薬品・研究所)

バイスン錠0.2 (保存条件：フェードメータ、70,000lx) 3ロット平均

測定項目	イニシャル	50万lx・hr	100万lx・hr
外 観	白色の錠剤	変化なし	変化なし
崩壊時間(分)	8.8	8.6	8.4
残 存 率(%)	100	100.0	100.5

(武田薬品・研究所)

バイスンOD錠0.2 (保存条件：D65ランプ、2,000lx) 1ロット

測定項目	イニシャル	60万lx・hr	120万lx・hr
外 観	帯黄白色の錠剤	変化なし	変化なし
溶 出 試 験	適合	適合	適合
残 存 率(%)	100	100.2	100.4

バイスンOD錠0.3 (保存条件：D65ランプ、2,000lx) 1ロット

測定項目	イニシャル	60万lx・hr	120万lx・hr
外 観	微黄色の錠剤	変化なし	変化なし
溶 出 試 験	適合	適合	適合
残 存 率(%)	100	100.0	101.0

(武田薬品・研究所)

(3) PTP状態での安定性 (保存条件：25℃、93%RH、1ロット)

1) バイスンOD錠0.2

測定項目	イニシャル	1カ月	2カ月	3カ月
外 観	帯黄白色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
溶 出 試 験	適合	適合	適合	適合
硬 度(N)	33~39	28~35	25~30	25~29
残 存 率(%)	100	100.3	99.5	99.8

2) バイスンOD錠0.3

測定項目	イニシャル	1カ月	2カ月	3カ月
外 観	帯黄白色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
溶 出 試 験	適合	適合	適合	適合
硬 度(N)	29~35	27~29	22~26	21~24
残 存 率(%)	100	101.5	100.7	100.5

(武田薬品・研究所)

7. 調製法及び溶解後の安定性

---

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

---

該当資料なし

9. 溶出性

---

ベイスン錠、ベイスン OD 錠

溶出試験法・パドル法

10. 容器・包装

---

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

---

該当しない

(2) 包装

---

錠 0.2 : 100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]、500 錠 [10 錠 (PTP) × 50]、  
1000 錠 [10 錠 (PTP) × 100]、2100 錠 [21 錠 (PTP) × 100]、  
500 錠 [ガラス瓶、バラ]

錠 0.3 : 100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]、500 錠 [10 錠 (PTP) × 50]、  
1000 錠 [10 錠 (PTP) × 100]、2100 錠 [21 錠 (PTP) × 100]、  
500 錠 [ガラス瓶、バラ]

OD 錠 0.2 : 100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]、500 錠 [10 錠 (PTP) × 50]、  
1000 錠 [10 錠 (PTP) × 100]、2100 錠 [21 錠 (PTP) × 100]

OD 錠 0.3 : 100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]、500 錠 [10 錠 (PTP) × 50]、  
1000 錠 [10 錠 (PTP) × 100]、2100 錠 [21 錠 (PTP) × 100]

(3) 予備容量

---

該当しない

(4) 容器の材質

---

◇ベイスン錠

PTP 包装：PTP シート（ポリプロピレンフィルム）、内袋、紙箱

バラ包装：ガラス瓶、金属キャップ、紙箱

◇ベイスン OD 錠

PTP 包装：PTP シート（ポリプロピレンフィルム）、内袋（アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム）、紙箱

11. 別途提供される資材類

---

該当しない

12. その他

---

該当しない

## V：治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

〈ベイスン錠 0.2、0.3〉〈ベイスン OD 錠 0.2、0.3〉

○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)

〈ベイスン錠 0.2〉〈ベイスン OD 錠 0.2〉

○耐糖能異常における 2 型糖尿病の発症抑制 (錠 0.2、OD 錠 0.2 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)

### 2. 効能又は効果に関連する注意

#### 5. 効能又は効果に関連する注意

〈効能共通〉

5.1 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。

〈糖尿病の食後過血糖の改善〉

5.2 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。

5.3 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。

〈耐糖能異常における 2 型糖尿病の発症抑制 (錠 0.2、OD 錠 0.2 のみ)〉

5.4 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 ヶ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。

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

〈糖尿病の食後過血糖の改善〉

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 (錠 0.2、OD 錠 0.2 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。

## (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

〔V.5.(3) 用量反応探索試験〕参照

## 4. 用法及び用量に関連する注意

### 7. 用法及び用量に関連する注意

高齢者では、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。〔9.8、11.1.1、11.1.2 参照〕

## 5. 臨床成績

### (1) 臨床データパッケージ

○耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制（錠0.2、OD錠0.2のみ）

試験の区分	対象	試験の種類	用法・用量	投与期間
第Ⅱ相	耐糖能異常を有する者	二重盲検	プラセボ：1日3回毎食直前投与 AO-128：0.1mg 1日3回毎食直前投与 AO-128：0.2mg 1日3回毎食直前投与	8週間
第Ⅲ相	耐糖能異常を有する者	二重盲検	プラセボ：1日3回毎食直前投与 AO-128：0.2mg 1日3回毎食直前投与	144週以上 <sup>注)</sup>

注) ただし、2型糖尿病又は正常型と判定された時点で当該症例は投与終了とした。

### (2) 臨床薬理試験

健康成人を対象に、2mg単回、1mg単回、1mg1日3回×3日間、0.5mg1日3回×3日間及び0.2mg1日3回×3日間を経口投与して、食後血糖抑制効果及び有害事象を検討した。食後血糖抑制効果は単回投与では、1mgから認められ2mgではより高かった。反復投与では1mg及び0.5mgの第2投目から効果があり、0.2mgでは3日目の第3投目から効果が認められた。用法については、2mgを食事4時間前、2時間前、1時間前、食直前に単回経口投与して検討した結果、食直前投与がもっとも効果が認められた。持続性については、1mgの投与では次の食事時には効果が認められなかった。また、自覚的副作用は2mg単回投与で54.5%（18/33例）、1mg単回投与で78.3%（18/23例）、1mg反復投与で95.0%（19/20例）、0.5mg反復投与で88.9%（8/9例）、0.2mg反復投与で44.4%（4/9例）であり、内容は下痢、放屁の増加、腹鳴、腹部膨満感等の消化器症状がほとんどであった。

（ベイスン錠承認時資料：1994年7月）

### (3) 用量反応探索試験

#### ◇糖尿病の食後過血糖の改善

- (1) 食事療法のみあるいは食事療法と経口血糖降下剤を使用して、なお良好な血糖コントロールの得られないインスリン非依存型糖尿病の入院患者を対象に、本剤1回2mg及びプラセボを1日3回毎食直前に投与する10日間経口投与試験、ならびに本剤1回1mg及び0.5mgを1日3回毎食直前に投与する7日間経口投与試験を二重盲検クロスオーバー法で実施した。全般改善度の改善以上は2mg投与群66.7% (8/12例)、プラセボ投与群16.7% (2/12例)、1mg投与群71.4% (15/21例)、0.5mg投与群で73.7% (14/19例)であり、2mg投与群、1mg投与群及び0.5mg投与群で差は認められなかった。自他覚的副作用は2mg投与群92.3% (12/13例)、プラセボ投与群38.5% (5/13例)、1mg投与群53.8% (14/26例)、0.5mg投与群で46.2% (12/26例)であり、内容はすべてが腹部膨満感、放屁の増加等の消化器症状であり重篤なものはなかったが、0.5mg投与群でも高頻度であり、さらに低用量で検討する必要性が認められた。

(ベイスン錠承認時資料：1994年7月)

- (2) 食事療法のみあるいは食事療法と経口血糖降下剤を使用して、なお良好な血糖コントロールの得られないインスリン非依存型糖尿病の入院患者を対象に、本剤1回0.1mg、0.2mg及び0.3mgを1日3回毎食直前に4日ずつ経口投与する漸増法による試験及び1回0.05mgを1日3回毎食直前に7～12日間経口投与する試験を実施した。血糖改善度の改善以上は0.05mg投与群0% (0/10例)、0.1mg投与群46.7% (14/30例)、0.2mg投与群56.7% (17/30例)、0.3mg投与群62.1% (18/29例)であり、0.1mg、0.2mg、0.3mgのいずれの投与量でも血糖に対する効果は認められたが、0.05mgでは効果は認められなかった。自他覚的副作用は0.05mg投与群0% (0/13例)、0.1mg投与群13.3% (4/30例)、0.2mg投与群13.3% (4/30例)、0.3mg投与群17.2% (5/29例)であり、内容はすべて消化器症状であった。

以上の結果から、本剤の用量は1回0.2mgを中心に0.1mgから0.3mgと考えられたが、至適用量を確認するためには、更に多数例で群間比較試験により検討する必要があると考えられた。

(ベイスン錠承認時資料：1994年7月)

注) 本剤の糖尿病の食後過血糖の改善に対して承認されている用法・用量は「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。」である。

◇耐糖能異常における 2 型糖尿病の発症抑制

耐糖能異常を有する者 158 例を対象に、本剤の食後過血糖改善効果を指標とした用量反応性について、無作為化二重盲検群間比較法により検討した。

試験デザイン	無作為化 二重盲検 用量反応試験
対 象	WHO 判定基準による耐糖能異常を有する者
主な登録基準	対象観察期の OGTT 時における空腹時血糖が 125mg/dL 以下かつ血糖 2 時間値が 140 ~ 199mg/dL (170 ~ 199mg/dL) の者 注) 括弧内は 2000 年 1 月 17 日付けの改訂前の基準
主な除外基準	(1) 糖尿病と診断された既往がある者 (2) 明らかな耐糖能異常を示す、あるいは示す可能性のある疾患・病態を有する者 (3) 対象観察期開始前 4 週間以内に血糖に影響を及ぼす薬剤を使用した者
試験方法	本剤 1 回 0.1mg、0.2mg 又はプラセボを 1 日 3 回毎食直前に 8 週間経口投与
主要評価項目	空腹時血糖、食後血糖 1 時間値及び 2 時間値の 3 時点の血糖 AUC の対象観察期終了時から治療期終了時への変化率
結 果	血糖 AUC の変化率は、プラセボ投与群 $-1.61 \pm 11.31\%$ 、0.1mg 投与群 $-4.04 \pm 13.48$ 、0.2mg 投与群 $-5.12 \pm 12.63$ であり、群間比較では有意な差 (分散分析) を認めなかったが、群内比較では 0.1mg 投与群、0.2mg 投与群に有意な差が認められた (0.1mg 投与群 : $p=0.0353$ 、0.2mg 投与群 : $p=0.0048$ 、1 標本 t 検定)。また、その下降量は用量の増加とともに増大した。 因果関係が否定できない有害事象は 0.1mg 投与群 / 日群で 50.0% (26/52 例)、0.2mg 投与群 / 日群で 44.4% (24/54 例)、プラセボ群で 34.6% (18/52 例) であった。主な内容は鼓腸、下痢、腹部膨満、腸雑音異常、便秘、排便回数増加、胃不快感等の消化器症状及び血中 CPK 増加、ALT 増加、 $\gamma$ -GTP 増加、血中 LDH 増加、血中ビリルビン増加、白血球数減少等の臨床検査値異常であった。 以上の結果より、1 回 0.2mg 投与が至適用量であると推察された。

(承認時資料 : 2009 年 10 月)

注) 本剤の耐糖能異常における 2 型糖尿病の発症抑制に対して承認されている用法・用量は「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。」である。

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

###### ◇糖尿病の食後過血糖の改善

###### 国内第Ⅱ・Ⅲ相試験

インスリン非依存型糖尿病、インスリン依存型糖尿病の各患者を対象に、1日0.6mg又は0.9mgを、投与した二重盲検比較対照試験を含む各種臨床試験において、最終血糖総合改善度が評価された877例の糖尿病の病型別改善率は表のとおりである。

糖尿病の病型	例数	中等度改善以上	軽度改善以上
インスリン非依存型糖尿病	812	371 (45.7)	613 (75.5)
インスリン依存型糖尿病	65	31 (47.7)	47 (72.3)
計	877	402 (45.8)	660 (75.3)

数字は例数、( )内は累積パーセント  
中等度改善以上：「著明改善」+「中等度改善」

上記のインスリン非依存型糖尿病患者を対象とした二重盲検比較対照試験の結果、本剤の有用性が認められている。

また、食事療法のみ症例のみならず、インスリン製剤使用中あるいは経口血糖降下剤使用中の患者においても食後過血糖の改善を初めとする有用性が認められている。さらに、長期投与試験(平均投与期間約7カ月)では効果の持続が確認され、安定した血糖コントロールが得られている。

承認時までの試験では、1日0.6mg又は0.9mgを投与した965例中154例(16.0%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。主な副作用は下痢(4.0%)、放屁増加(4.0%)、腹部膨満(3.5%)等であった。

なお、臨床薬理試験結果より、代表的副作用である放屁増加、腹部膨満、下痢及び軟便等は、薬理作用に起因する未吸収糖質の分解・発酵に基づくものであると考えられる。

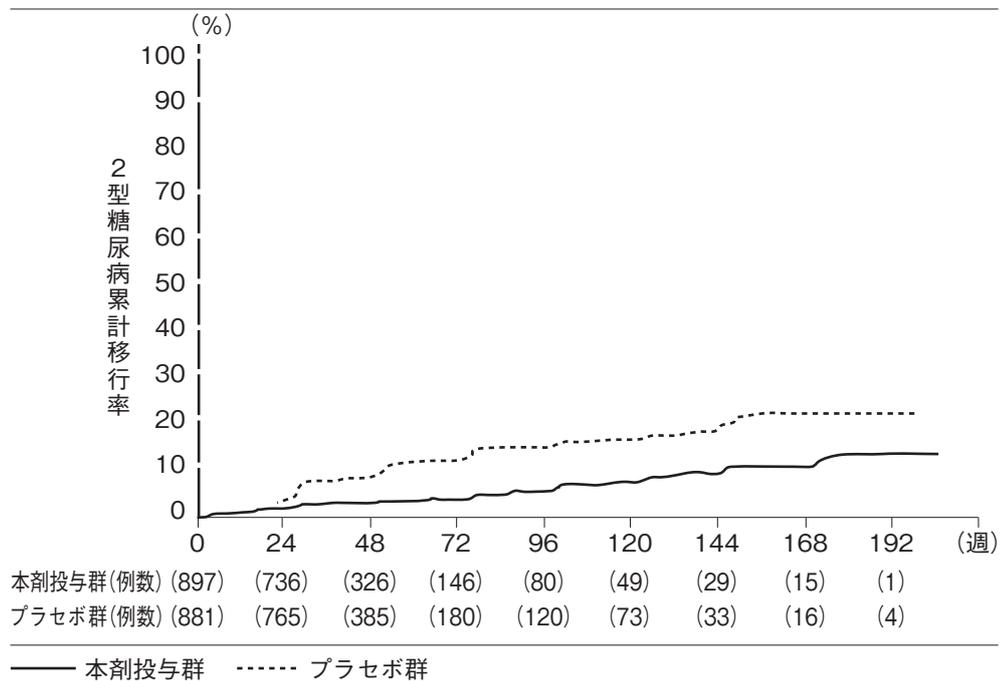
◇耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制（錠0.2、OD錠0.2のみ）

国内第Ⅲ相試験

耐糖能異常を有し、かつ高血圧症、高脂血症、肥満（Body Mass Index: BMI 25kg/m<sup>2</sup>以上）あるいは2親等以内の糖尿病家族歴のいずれかを有する者を対象に、食事療法・運動療法に加えて1回0.2mgを1日3回投与した二重盲検比較試験（平均投与日数336.7 ± 254.0日間）の結果、最終評価時点における2型糖尿病移行例数は、本剤投与群で50/897例、プラセボ群で106/881例である。

プラセボ群に対する本剤投与群のハザード比（両側95%信頼区間）は0.595（0.4334 - 0.8177）である（層別ログランク検定：p = 0.0014）。

なお、2型糖尿病累積移行率は図表のとおりである。



	2型糖尿病累積移行率	
	投与開始48週時点	投与開始96週時点
本剤投与群	2.6% (1.53-3.68)	4.8% (3.13-6.44)
プラセボ群	7.0% (5.23-8.73)	13.2% (10.59-15.85)

( )内は両側95%信頼区間

承認時までの試験では、1日0.6mgを投与した951例中452例（47.5%）に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。主な副作用は鼓腸（17.4%）、腹部膨満（13.1%）、下痢（12.0%）等であった。

(1) 無作為化平行用量反応試験

◇糖尿病の食後過血糖の改善

- 1) 食事療法のみでは良好な血糖コントロールの得られないインスリン非依存型糖尿病患者 416 例を対象に、本剤 1 回 0.2mg (H 群)、0.1mg (M 群)、0.05mg (L 群) 又はプラセボ (P 群) を 1 日 3 回毎食直前に 4 週間経口投与する二重盲検比較対照試験を実施し、至適用量を検討した。最終血糖総合改善度は中等度改善以上で H 群 44.6% (37/83 例)、M 群 16.3% (14/86 例)、L 群 14.5% (12/83 例) 及び P 群 21.3% (19/89 例) と H 群が他の 3 群に比較して有意な改善率を示し、他の 3 群間では差は認められなかった ( $p \leq 0.01$ 、Tukey の多重比較法)。自他覚的副作用は H 群 14.1% (14/99 例)、M 群 9.4% (9/96 例)、L 群 7.1% (7/99 例) 及び P 群 2.9% (3/105 例) と用量反応性がうかがえた。内容は放屁の増加、軟便、腹鳴、腹部膨満感等の消化器症状で、特に重篤なものは認められなかった。以上の結果から、1 回 0.2mg の投与により高い有用性が認められたが、0.1mg 以下の用量では不十分と判断された<sup>1)</sup>。

後藤由夫, 他: 臨牀と研究 1992, 69 : 1211

- 2) 食事療法のみでは良好な血糖コントロールの得られないインスリン非依存型糖尿病患者 156 例を対象に、本剤 1 回 0.2mg 又は 0.3mg を 1 日 3 回毎食直前に 4 週間経口投与する二重盲検比較対照試験を実施し、至適用量を検討した。最終総合血糖改善度は中等度改善以上で 0.2mg 投与群 48.6% (34/70 例)、0.3mg 投与群 47.1% (32/68 例) と有意な差は認められなかったが、著明改善率は 0.2mg 投与群 8.6% (6/70 例)、0.3mg 投与群 17.6% (12/68 例) と 0.3mg 投与群で高かった。自他覚的副作用は 0.2mg 投与群 6.6% (5/76 例) 及び 0.3mg 投与群 13.5% (10/74 例) と用量反応性がうかがえた。内容は下痢、腹部膨満感、放屁の増加等の消化器症状がほとんどであり、特に重篤なものは認められなかった。以上の結果から、本剤の用量は 1 回 0.2mg が妥当であるが、症例によって 1 回 0.3mg も選択し得る用量であると判断された<sup>2)</sup>。

後藤由夫, 他: 臨牀と研究 1992, 69 : 1237

注) 本剤の糖尿病の食後過血糖の改善に対して承認されている用法・用量は「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。」である。

(2) 比較試験

◇糖尿病の食後過血糖の改善

- 1) 食事療法のみでは良好な血糖コントロールが得られないインスリン非依存型糖尿病患者 250 例を対象に、本剤 1 回 0.2mg 又はプラセボを 1 日 3 回毎食直前に 8 週間経口投与する二重盲検比較対照試験を実施した。最終血糖総合改善度は中等度改善以上で 0.2mg 投与群 51.5% (51/99 例) 及びプラセボ投与群 20.2% (23/114 例) と 0.2mg 投与群で有意に優れていた ( $p \leq 0.01$ 、 $\chi^2$  検定)。自他覚的副作用は 0.2mg 投与群 11.3% (13/115 例) 及びプラセボ投与群 6.3% (8/128 例) に認められたが、両群間に有意な差は認めなかった。0.2mg 投与群で認めら

れた副作用はすべて消化器症状であった。以上の結果から、食事療法のみのインスリン非依存型糖尿病患者に対し1回0.2mgを1日3回投与で特に問題となる副作用は認められず、有用性を有することが確認された<sup>3)</sup>。

後藤由夫, 他: 医学のあゆみ 1992, 160: 943

- 2) 食事療法のみでは良好な血糖コントロールが得られないインスリン非依存型糖尿病患者 89 例を対象に、本剤1回0.2mg又はプラセボを1日3回毎食直前に28週間経口投与する二重盲検比較対照試験を実施した。最終血糖総合改善度は中等度改善以上で0.2mg投与群45.2%(19/42例)及びプラセボ投与群15.9%(7/44例)と0.2mg投与群で有意に優れていた( $p \leq 0.01$ 、 $\chi^2$ 検定)。自覚的副作用は0.2mg投与群4.8%(2/42例)に認められプラセボ投与群では認められず、内容は下痢及び胃痛が各1例であった。以上の結果から、食事療法のみのインスリン非依存型糖尿病患者の長期にわたる血糖コントロールに対して、有用性の高い薬剤であると考えられた<sup>4)</sup>。

神谷文雄, 他: 臨床成人病 1992, 22: 573

#### ◇耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制

耐糖能異常を有する者1,778例を対象に、本剤0.2mg又はプラセボを1日3回毎食直前に144週以上投与する二重盲検比較試験により、耐糖能異常から2型糖尿病までの移行期間について検討した。

試験デザイン	無作為化 二重盲検
対 象	WHO 判定基準による耐糖能異常を有する者
主な登録基準	①観察期開始時 OGTT の空腹時血糖が 125mg/dL 以下かつ血糖 2 時間値が 140～199mg/dL で、以下の②～⑤のいずれかに該当する者 ②高血圧症合併又は観察期開始時の血圧が正常高値である者 ③高脂血症合併 ④肥満 (BMI25 以上) ⑤2 親等以内に糖尿病家族歴がある者
主な除外基準	(1) 糖尿病と診断された既往がある者 (2) 明らかな耐糖能異常を示す、あるいは示す可能性のある疾患・病態を有する者
試験方法	観察期 4 週後、本剤 0.2mg 錠又はプラセボ錠を 1 回 1 錠 1 日 3 回毎食直前に経口投与する。本剤の投与期間は 144 週以上ただし、2 型糖尿病又は正常型と判定された時点で、当該症例の投与を終了。
主要評価項目	耐糖能異常から 2 型糖尿病への移行
結 果	最終評価時点における 2 型糖尿病累積移行例数はプラセボ群の 106/881 例に対して 0.2mg 投与群では 50/897 例であり、プラセボ群に対して 0.2mg 投与群は 2 型糖尿病への発症リスクを 40.5% 低減し有意な差 (層別ログランク検定、 $P=0.0014$ ) を認めた。本剤と因果関係が否定できない有害事象は 0.2mg 投与群で 47.7% (428/897 例)、プラセボ群で 29.2% (257/881 例) であった。主な内容は鼓腸、腹部膨満、下痢、便秘及び腸雑音異常、排便回数増加、胃不快感等の消化器症状及び血中 CPK 増加、ALT 増加であった。

(承認時資料: 2009 年 10 月)

## 2) 安全性試験

食事療法のみでは良好な血糖コントロールの得られないインスリン非依存型糖尿病患者 72 例を対象に、本剤 1 回 0.2mg 1 日 3 回毎食直前に 8 週間経口投与し、その後症状により 1 回用量を 0.1mg に減量又は 0.3mg に増量可能とし、28 週間ないしそれ以上の投与を目標とする試験を実施した。1 回投与量は、0.2mg が 56 例 (83.6%)、0.2mg から 0.3mg に増量した例が 10 例 (14.9%) であり、期間中に減量された症例はなかった。平均投与日数は 271.4 日 (9.0 カ月) であり、6 カ月 (28 週) 以上投与された症例が 29 例 (43.3%)、1 年 (52 週) 以上は 22 例 (32.8%) であった。最終血糖総合改善度は中等度改善以上で 45.5% (30/66 例) であり、自他覚的副作用は消化器症状が 12.7% (9/71 例) に認められたが、治療 8 週以降に発現した副作用は、悪心 1 例のみであった。以上の結果から、食事療法のみでのインスリン非依存型糖尿病患者に対して長期投与により安全性にも特に問題はなく、高い有用性が期待できると考えられた<sup>5)</sup>。

三村和郎，他：臨牀と研究 1992, 69 : 919

## (5) 患者・病態別試験

---

### 1) SU 剤との併用での検討

SU 剤を使用してなお良好な血糖コントロールが得られないインスリン非依存型糖尿病患者 79 例を対象に、本剤 1 回 0.2mg 又は 0.3mg 1 日 3 回毎食直前に 28 週間以上経口投与する試験を実施した。最終総合血糖改善度は中等度以上で 29.7% (22/74 例) であり、自他覚的副作用は 7.6% (6/79 例) に認められ、その内容は口渇、酩酊感、眼の乾燥感が 12 週以降に発現した以外、すべて消化器症状であり、4 週後までに発現した。以上の結果から、SU 剤を使用してなお良好な血糖コントロールが得られないインスリン非依存型糖尿病患者に長期併用するのに有用な薬剤と考えられた<sup>6)</sup>。

梅田文夫，他：臨牀と研究 1992, 69 : 1309

### 2) インスリン製剤との併用での検討

1 日のインスリン使用量が比較的安定しているインスリン依存型糖尿病患者 27 例を対象に、本剤 1 回 0.2mg 又は 0.3mg 1 日 3 回毎食直前に 8 週間経口投与する試験を実施した。最終総合血糖改善度は中等度改善以上で 37.0% (10/27 例) であり、自他覚的副作用は認められなかった。また、本剤投与前に低血糖症状を示していた例では、低血糖症状及び低血糖の発現頻度に影響を及ぼさなかった。以上の結果から、インスリン依存型糖尿病に対して、インスリン製剤との併用で安全性にも特に問題なく有用性のある薬剤であると考えられた<sup>7)</sup>。

池田義雄，他：新薬と臨牀 1992, 41 : 20

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

◇糖尿病の食後過血糖の改善

再審査結果公表年月日：2004年9月9日

内容：薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない。

◇耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制

再審査結果公表年月日：2017年3月30日

内容：医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第14条第2項第3号イからハまでのいずれにも該当しない。

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

◇耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制

本剤投与中止後の追跡調査を含む製造販売後臨床試験及び長期使用に関する特定使用成績調査を速やかに行い、その結果を報告するとともに、医療機関に対し必要な情報提供を迅速かつ確実に行うこと。

1) 長期使用に関する特定使用成績調査

<調査の目的>

耐糖能異常（Impaired Glucose Tolerance, 以下 IGT）に対する本剤長期使用時の安全性及び有効性を検討した。

<調査の方法>

観察期間：本剤の投与開始日から72週間（約1年6ヵ月）。

ただし、①2型糖尿病の発症を確認した場合、②正常型への移行を確認した場合、③何らかの理由で本剤の投与を終了した場合のいずれかに該当することが判明した時点で調査は終了。

調査方式：中央登録方式

調査実施期間：2009年11月18日～2013年8月31日

<結果>

[安全性]

副作用の発現頻度は7.71%（55/713例）であり、69件の副作用がみられた。主な副作用は、腹部膨満が14件（1.96%）、下痢が13件（1.82%）、鼓腸及び肝機能異常がそれぞれ7件（0.98%）、便秘が6件（0.84%）であった。低血糖及び重篤な副作用及び長期投与に関して懸念すべき特徴的な副作用はみられなかった。

[有効性]

調査期間において2型糖尿病を発症した症例は4.8%（34/708例）と少なく、1,000人年あたりの2型糖尿病発症率は42.12に対し、1,000人年あたりの正常型移行率は101.91であっ

た。

患者背景要因に関する検討では、2型糖尿病の発症率は、75g 経口ブドウ糖負荷試験（以下、75gOGTT）空腹時血糖値が低い症例で低く、正常型への移行率は、本剤投与前の食事療法・運動療法の実施期間が長い症例、生活活動強度が高い症例、75gOGTT 空腹時血糖値及び75gOGTT 血糖 2 時間値が低値の症例、2 親等以内の糖尿病家族歴なしの症例で高い傾向がみられた。

食事療法・運動療法の確実な実施と生活活動強度の高さが正常型への移行に重要な要因と考えられた。

## 2) 製造販売後臨床試験

### <試験の目的>

食事療法又は運動療法を実施するも効果不十分な IGT を対象に、本剤 0.6mg/ 日の有効性及び安全性を非盲検で検討するとともに、正常型と判定された症例を対象に投与終了後の経過について追跡調査した。

### <試験の方法>

試験期間：スクリーニング期 1 週間以内、治療期 96 週間以上、追跡調査 48 週間とした。ただし、治療中に 2 型糖尿病又は正常型と判定された場合は、その時点で治療期を終了し、正常型と判定された症例のみ追跡調査へ移行した。追跡調査中に IGT 又は 2 型糖尿病と判定された場合は、その時点で追跡調査を終了した。

試験方法：非盲検試験

試験実施期間：2010 年 3 月～ 2012 年 11 月

### <結 果>

#### [安全性]

副作用の発現頻度は 37.6% (74/197 例) であった。発現頻度が 3% 以上の副作用は、鼓腸が 14.2% (28/197 例)、腹部膨満が 12.7% (25/197 例)、下痢が 9.1% (18/197 例) 及び便秘 4.1% (8/197 例) であった。本剤の作用機序から考えられる胃腸障害の発現頻度が高かったものの、本剤の承認時までの臨床試験でみられた副作用の発現頻度と同様であった。

#### [有効性]

治療期における移行判定では正常型及び IGT に移行した症例がほぼ 9 割を占め、2 型糖尿病へ移行した症例が最も少なく、2 型糖尿病への発症抑制に対して有効な薬剤であることが示唆された。

正常型と判定された症例の投与終了後の経過の追跡結果では約 9 割が IGT へと移行し、2 型糖尿病への移行は少数であった。正常型と判定され本剤の投与を終了した症例では、糖代謝関連検査等を含む経過観察を定期的に行うことが必要であると考えられた。

3) 結 論

長期使用に関する特定使用成績調査及び製造販売後臨床試験を実施した結果、安全性及び有効性に関して懸念すべき問題はみられなかった。

(7) その他

---

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

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

本剤は、腸管において二糖類から単糖への分解を担う二糖類水解酵素（ $\alpha$ -グルコシダーゼ）を阻害し、糖質の消化・吸収を遅延させることにより食後の過血糖を改善する<sup>8) 9) 10)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### (1) $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害作用 (*in vitro*)

ボグリボースは、ラット小腸粘膜由来の $\alpha$ -グルコシダーゼ（マルターゼ、イソマルターゼ、スクラーゼ）に対して、 $1.7 \times 10^{-8} \sim 3.9 \times 10^{-9}$ の低濃度で阻害作用を示した。

一方、ブタ膵由来の $\alpha$ -アミラーゼに対しては、 $2.0 \times 10^{-2}$ の高濃度で50%阻害作用を示すにすぎなかった。

また、ボグリボースの $\alpha$ -グルコシダーゼとの結合親和性は、当該する基質に比べて約 $10^6 \sim 10^7$ 倍高かった<sup>8)</sup>。

#### ■ 酵素活性を50%阻害するのに要する薬剤濃度

酵 素	薬 剤	薬剤濃度 (IC <sub>50</sub> ) (M)						
		10 <sup>-9</sup>	10 <sup>-8</sup>	10 <sup>-7</sup>	10 <sup>-6</sup>	10 <sup>-5</sup>	10 <sup>-4</sup>	10 <sup>-1</sup>
マルターゼ	ボグリボース	6.4×10 <sup>-9</sup>						
	アカルボース	1.7×10 <sup>-6</sup>						
イソマルターゼ	ボグリボース	1.7×10 <sup>-8</sup>						
	アカルボース	6.6×10 <sup>-5</sup>						
スクラーゼ	ボグリボース	3.9×10 <sup>-9</sup>						
	アカルボース	7.3×10 <sup>-7</sup>						
$\alpha$ -アミラーゼ (ブタ膵由来)	ボグリボース	2.0×10 <sup>-2</sup>						
	アカルボース	5.9×10 <sup>-6</sup>						

#### ■ $\alpha$ -グルコシダーゼに対する阻害定数

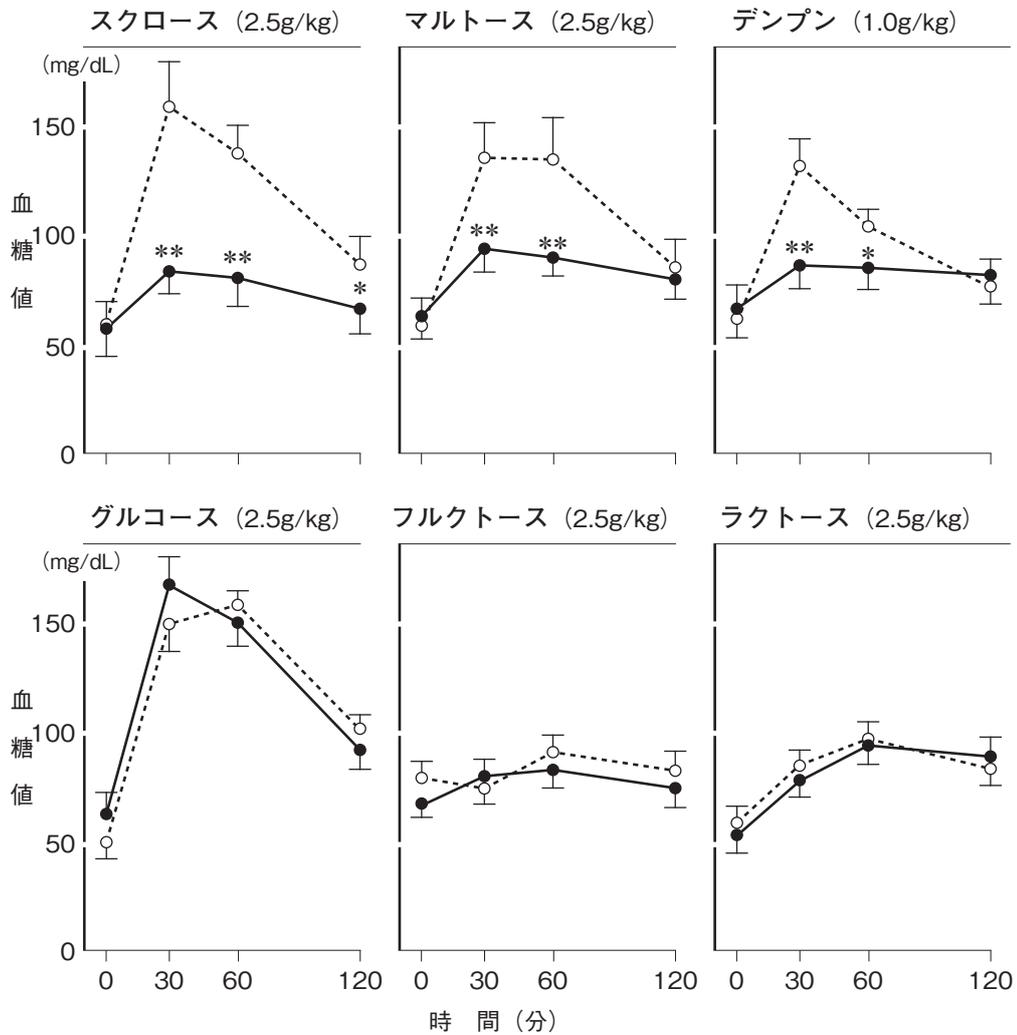
酵 素	Ki (M)		Km (M) [ ] 内は該当する基質
	ボグリボース	アカルボース	
マルターゼ	1.5×10 <sup>-9</sup>	3.6×10 <sup>-7</sup>	8.1×10 <sup>-3</sup> [マルトース]
イソマルターゼ	7.0×10 <sup>-9</sup>	3.7×10 <sup>-5</sup>	4.2×10 <sup>-3</sup> [イソマルトース]
スクラーゼ	1.6×10 <sup>-9</sup>	4.1×10 <sup>-7</sup>	2.3×10 <sup>-2</sup> [スクロース]

Ki：阻害定数、Km：ミカエリス定数

(2) 糖質経口負荷後の血糖上昇抑制作用 (ラット)

ボグリボースは、スクロース、マルトース及びデンプン負荷後の血糖上昇を抑制したが、単糖であるグルコース、フルクトース及び $\beta$ -グルコシダーゼで水解されるラクトース負荷後の血糖上昇には影響しなかった<sup>8)</sup>。

■糖質負荷後の血糖値の推移



●- ボグリボース 0.43mg/kg    -○- 対照    平均値±標準偏差 (各群 n=5~6)  
\* : p<0.05, \*\* : P<0.001 (対照との比較、t検定)

[試験方法]

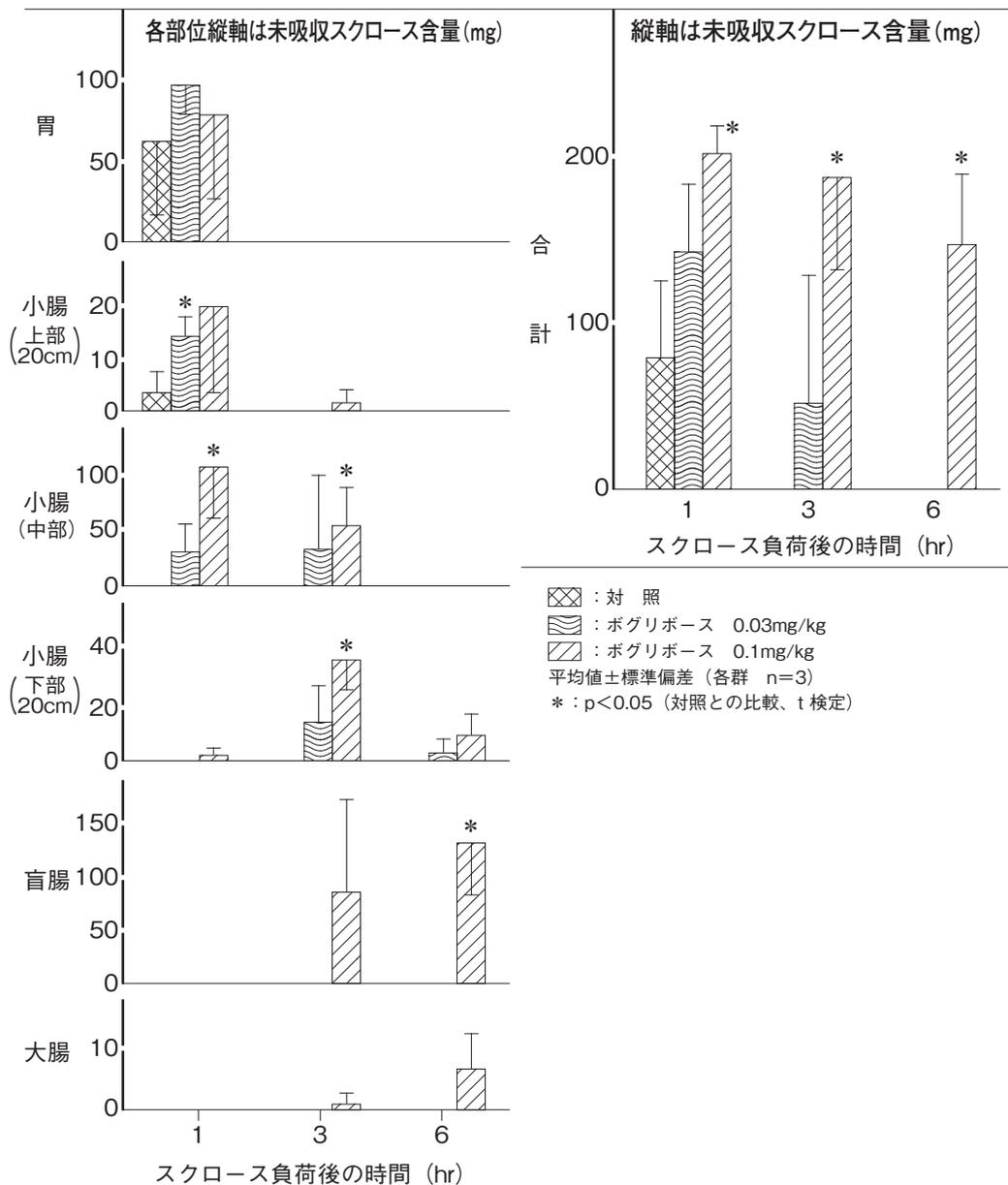
20時間絶食したSDラットにボグリボース 0.43mg/kgを各種糖質と同時に経口投与し、投与前、投与後30分、60分及び120分に血糖値を測定した。

(3) 糖質の吸収遅延作用と吸収抑制作用 (ラット)

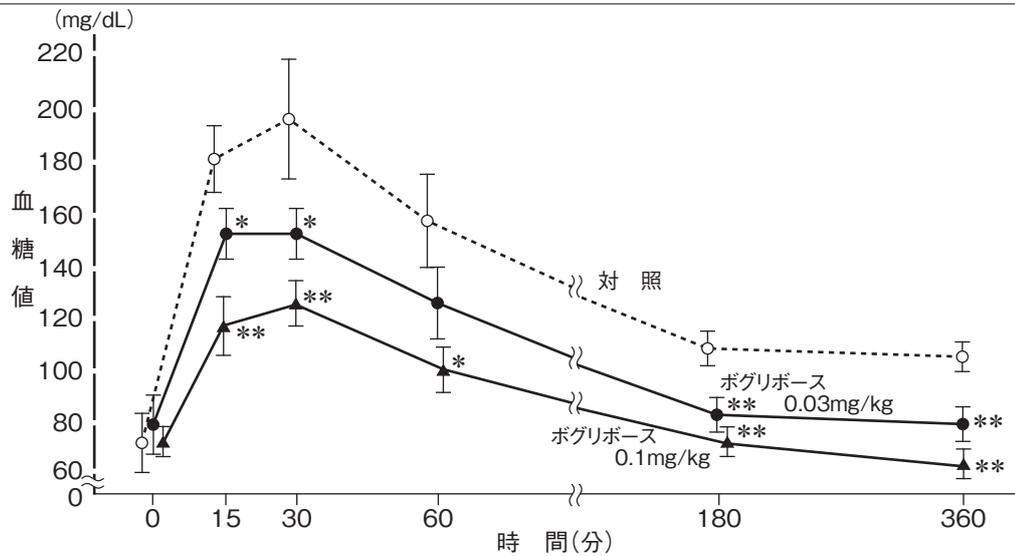
ラットにボグリボース 0.03mg/kg、0.1mg/kg をスクロースと同時に経口投与すると、血糖値の上昇はボグリボース非投与時に比べ用量依存的に抑制された。ボグリボース非投与ラットではスクロースは小腸上部において速やかに吸収され、肝グリコーゲン量は速やかに増加した。一方、ボグリボース 0.03mg/kg 投与ラットではスクロースの吸収は遅く、6 時間後にはほぼ吸収され、肝グリコーゲンの増加は緩徐であったが、3 時間以降はボグリボース非投与ラットより多くなった。ボグリボース 0.1mg/kg 投与ラットは、スクロースの分解阻害がみられ 6 時間後にも盲腸及び大腸内に検出され、肝グリコーゲン含量はまったく増加しなかった。

このことから、ラットではボグリボース 0.1mg/kg 投与で糖質の吸収が阻害されるが、ボグリボース 0.03mg/kg 投与では、糖質の吸収が遅延されると推定された<sup>9)</sup>。

■スクロース負荷後に消化管に残存するスクロース含量 (mg) の推移

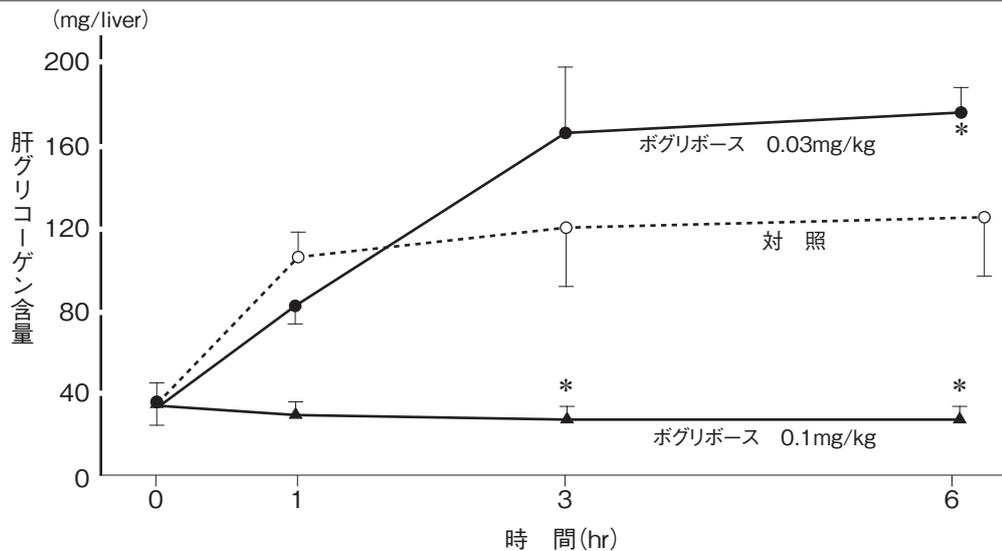


## ■スクロース負荷後の血糖値の推移



平均値±標準偏差 (各群 n=3~6)、\* : p<0.05、\*\* : p<0.001 (対照との比較、t検定)

## ■スクロース負荷後の肝グリコーゲン含量の推移



平均値±標準偏差 (各群 n=3~9)、\* : p<0.05 (対照との比較、t検定)

### [試験方法]

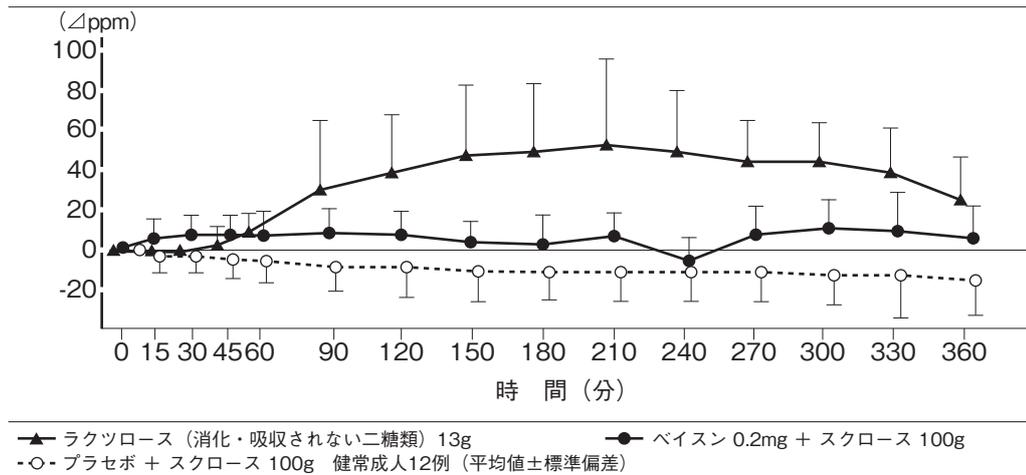
20時間絶食したSDラットにボグリボース 0.03mg/kg 又は 0.1mg/kg をスクロース 2.5g/kg と同時に経口投与し、1/4、1/2、1、3、6時間後の血糖値及び1、3、6時間後に屠殺し、消化管内に残存する未吸収のスクロース含量及び肝グリコーゲン含量を測定した。

(4) スクロースの消化・吸収に及ぼす影響（健康成人）

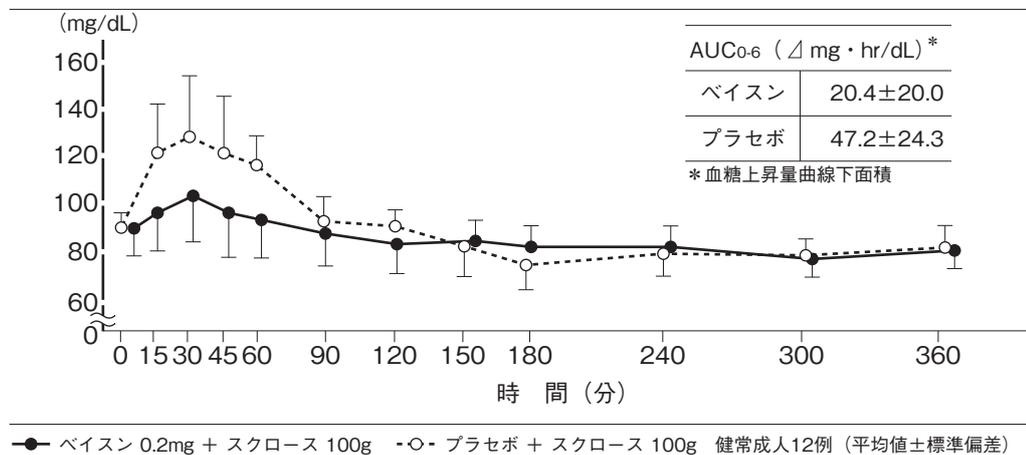
健康成人にバイスン 0.2mg をスクロース 100g と同時に経口投与すると、血糖値の上昇はバイスン非投与時に比べ著明に抑制された。また、呼気中水素ガス濃度からみた、スクロースの吸収阻害量は 0～9.0g に分布し、平均  $5.0 \pm 3.3$ g であった。

このことより、バイスンの作用機序は、小腸上部ないし中部において吸収が軽度に阻害されたスクロースが、下部まで輸送される間に徐々に消化・吸収された結果としての吸収遅延作用であると推測された<sup>10)</sup>。

■呼気中水素ガス濃度の推移（投与前値に対する変化量）



■スクロース負荷後の血糖値に及ぼす影響



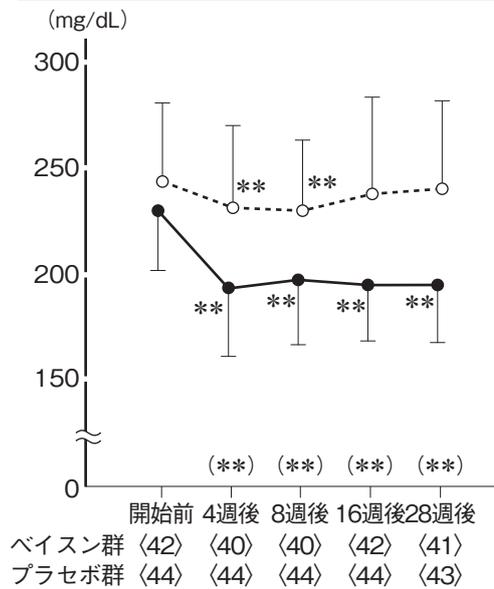
[試験方法]

健康成人 12 例を対象に、薬剤投与前にラクツロース（消化・吸収されない二糖類）13g を負荷し、呼気中の水素ガス濃度を経時的にガスクロマトグラフィーにより測定した。その後、バイスン 0.2mg 又はプラセボを 1 日 3 回 4 日間投与し、5 日目の早朝絶食下、バイスン 0.2mg 又はプラセボ投与 10 分後にスクロース 100g を負荷し、血糖値及び呼気中水素ガス濃度を測定した。

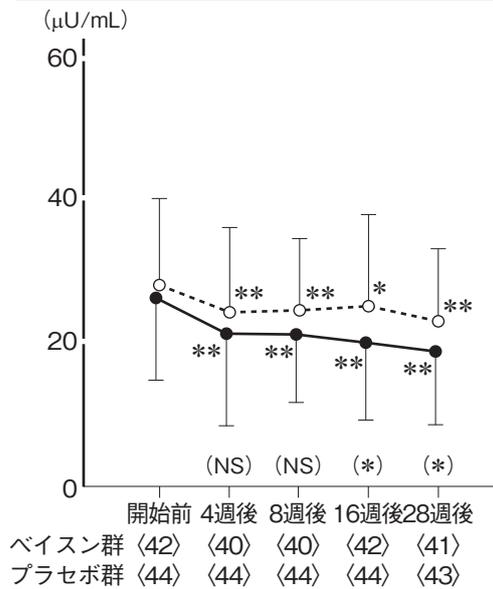
(5) 食後過血糖改善作用

ベイスン投与により、食後血糖 1 時間値はプラセボ投与群に比べて投与 4 週時点から有意に低下し、また、血中インスリン濃度の低下が認められ、投与 16 週、28 週時点ではプラセボ投与群に比べて有意に低下した<sup>4)</sup>。

■食後血糖 1 時間値の推移



■血中インスリン食後 1 時間値の推移



● ベイスン投与群 ○ プラセボ群  
 平均値±標準偏差、〈 〉内は症例数  
 検定 群内：開始前からの変化量についての1標本 t 検定  
 群間：開始前からの変化量についての U 検定、結果を( )内に表示  
 \*\*: P≤0.01、\* : P≤0.05

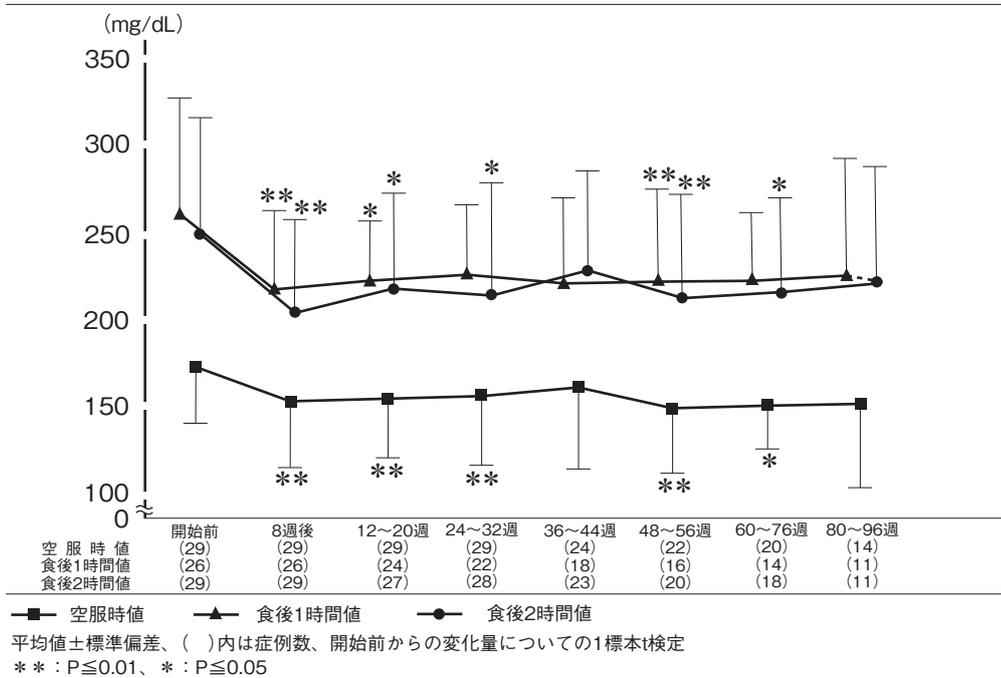
[試験方法]

食事療法のみでは良好な血糖コントロールが得られないインスリン非依存型糖尿病患者を対象に、ベイスン 1 回 0.2mg 又はプラセボを 1 日 3 回 28 週間経口投与する二重盲検比較対照試験を実施した。

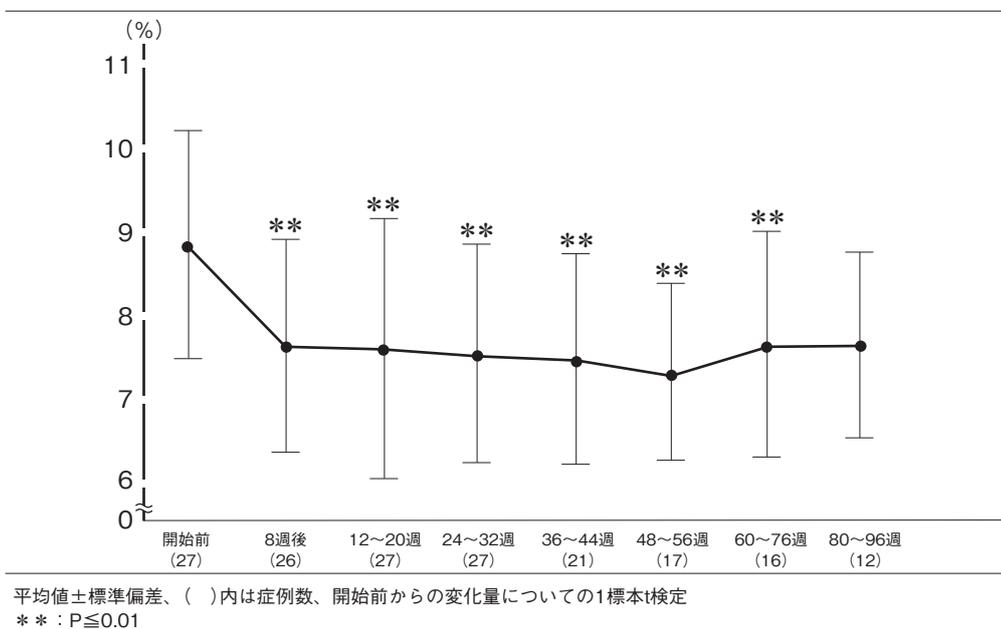
(6) HbA1c に及ぼす影響

バイソン 28 週間以上継続投与例では、食後過血糖の改善及びそれに伴う空腹時血糖、HbA1c の有意な低下が認められた<sup>5)</sup>。

■ 血糖値の推移



■ HbA1c (JDS 値) の推移



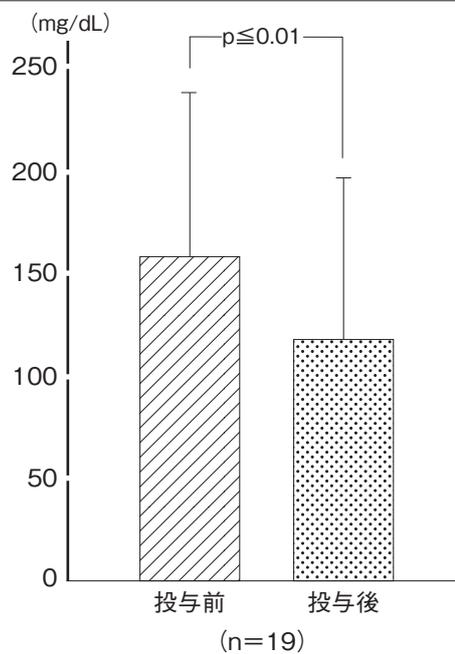
[試験方法]

食事療法のみでは良好な血糖コントロールが得られないインスリン非依存型糖尿病患者を対象に、バイソン 1 回 0.2mg (8 週間投与後は 0.3mg に増量可) を 1 日 3 回 28 週間以上経口投与した。

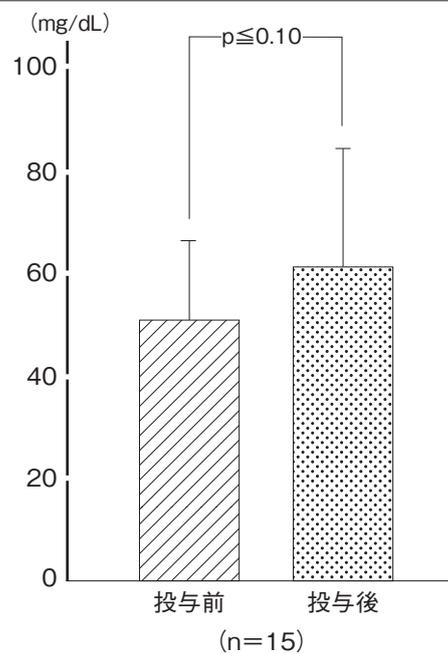
(7) 血清脂質に及ぼす影響

ベイスン 56 週間継続投与例では、糖代謝の改善に起因すると考えられる血清脂質の変動がみられ、トリグリセライドが有意に低下し、HDL-コレステロールの上昇が認められた<sup>5)</sup>。

■ 投与前後のトリグリセライドの変化



■ 投与前後の HDL - コレステロールの推移



平均値±標準偏差、開始前からの変化量についての1標本 t 検定

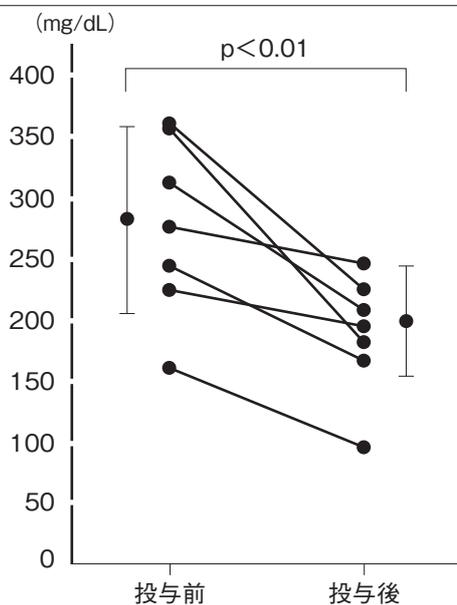
[試験方法]

食事療法のみでは良好な血糖コントロールが得られないインスリン非依存型糖尿病患者を対象に、ベイスン 1 回 0.2mg (8 週間投与後は 0.3mg に増量可) を 1 日 3 回 56 週間以上経口投与した。

(8) インスリン感受性に及ぼす影響

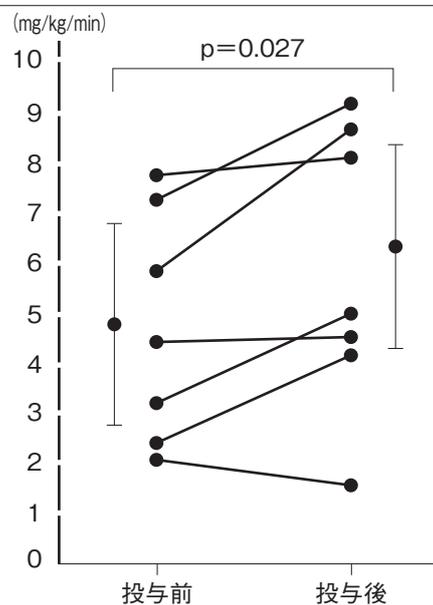
ベイスン 4 週間投与により、食後 2 時間の血糖値の有意な低下とともに、GIR (glucose infusion rate) の有意な上昇が認められた<sup>11)</sup>。

■投与前後の食後血糖 2 時間値の変化



平均値±標準偏差、paired t-test

■投与前後の GIR の変化



[試験方法]

空腹時血糖が比較的良好で食後高血糖が著明であり、かつ高度の肥満のないインスリン非依存型糖尿病患者 7 例を対象に、ベイスン 1 回 0.2mg を 1 日 3 回 4 週間経口投与した。GIR は投与前後に人工膵臓 (STG-22) を用いたグルコースクランプ法により、目標血糖値を 90mg/dL に維持し、開始後約 150 分の定常状態において測定した。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII：薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移

#### (1) 治療上有効な血中濃度

本剤は経口投与後、腸内で二糖類分解酵素に作用するので該当しない。

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

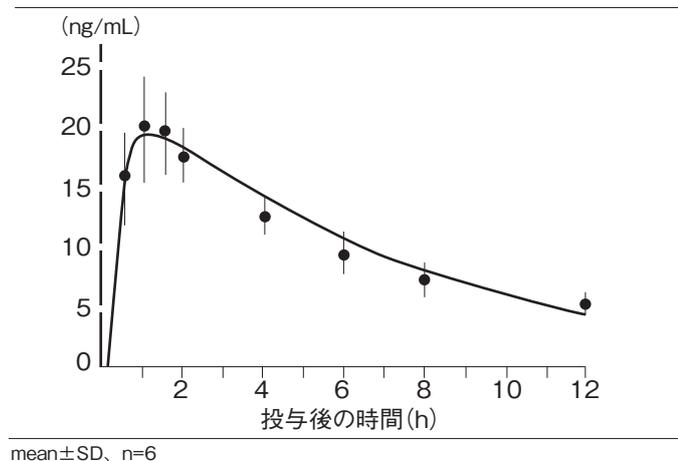
##### (1) 血中濃度

健康成人男性 6 例にボグリボース 1 回 0.2mg 1 日 3 回毎食直前に 7 日間経口投与したとき、また、健康成人男性 10 例にボグリボース 1 回 2mg を食直前に単回経口投与したとき、いずれも血漿中にボグリボースは検出されなかった（検出限界 10ng/mL）<sup>12)</sup>。

[海外データ]

健康成人男性 6 例に、ボグリボース 1 回 80mg を食直前に単回経口投与したときの血中濃度は下図のとおりであり、 $T_{max}$ 、 $C_{max}$ 、 $t_{1/2}$  及び  $AUC_{0-24}$  はそれぞれ  $1.67 \pm 1.35h$ 、 $20.7 \pm 9.0ng/mL$ 、 $5.33 \pm 1.94h$  及び  $168 \pm 37ng \cdot h/mL$  (mean  $\pm$  SD) であった。

#### ■ 80mg 単回投与時の血中濃度の推移



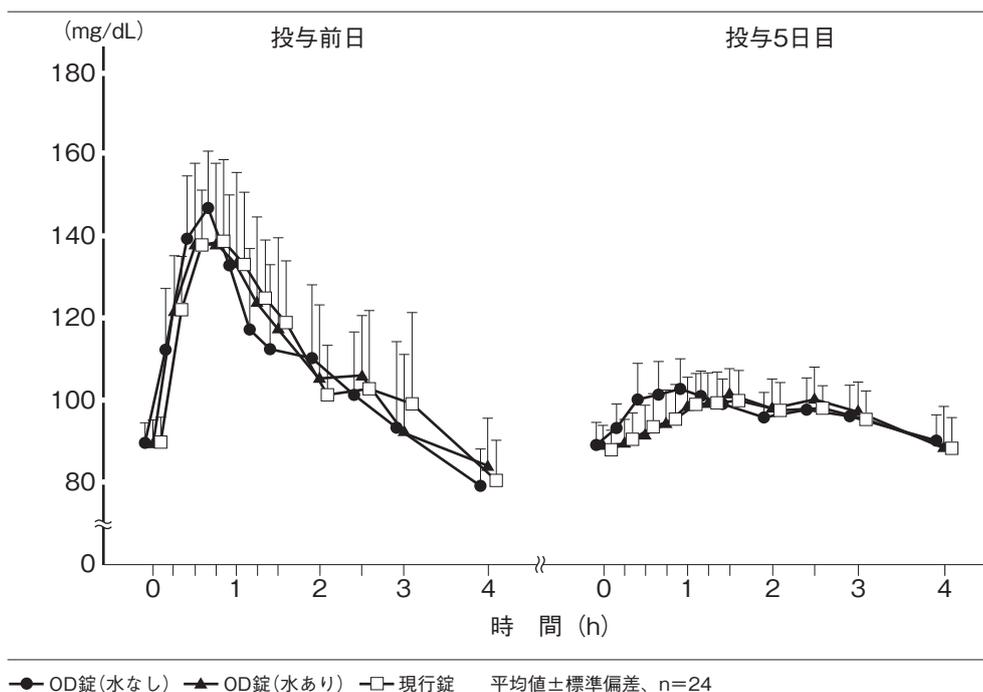
(バイスン錠承認時資料：1994年7月)

注：承認されている本剤の用法及び用量は「1回0.2mgを1日3回毎食直前に経口投与する。糖尿病の食後過血糖の改善では、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。」である。

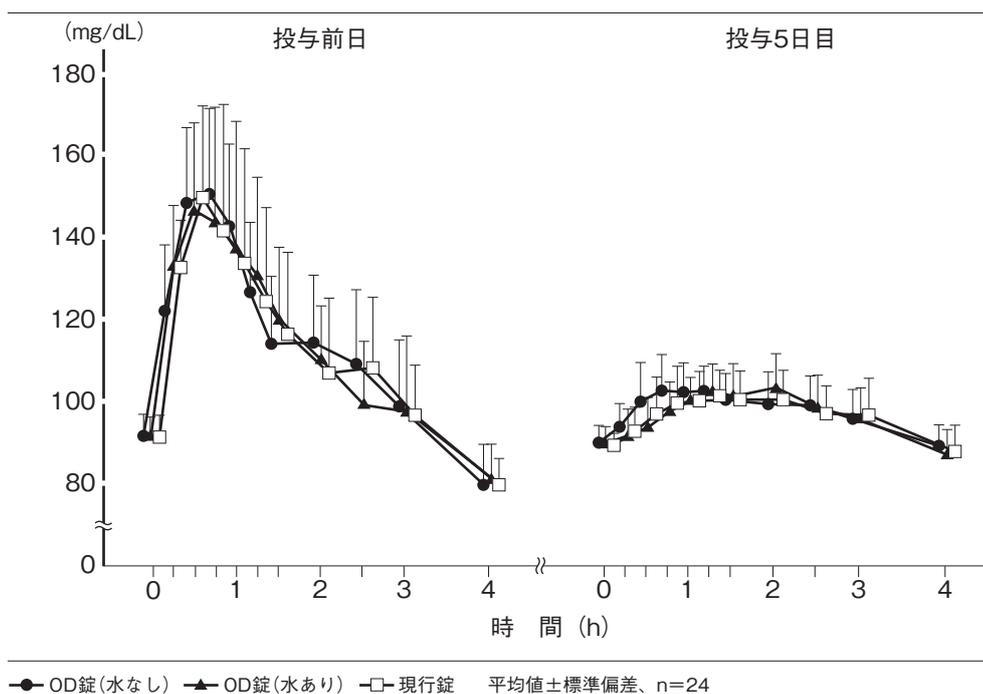
(2) バイスン錠とバイスン OD 錠の生物学的同等性

健康成人男性 24 例を対象に、バイスン錠とバイスン OD 錠（水とともに投与及び水なし投与）を 1 日 3 回 5 日間毎食直前にクロスオーバー法で経口投与して、シヨ糖負荷後の血漿中グルコース濃度抑制効果を指標に生物学的同等性を検討した。バイスン錠及びバイスン OD 錠の血漿中グルコース濃度抑制効果（ $C_{max}$ ）に差は認められなかった。

■ バイスン投与前後のシヨ糖負荷後の血漿中グルコース濃度の推移 (0.2mg)



■ バイスン投与前後のシヨ糖負荷後の血漿中グルコース濃度の推移 (0.3mg)



(バイスン OD 錠承認時資料：2004 年 2 月)

(3) 中毒域 \_\_\_\_\_  
該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響 \_\_\_\_\_  
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) 消失速度定数 \_\_\_\_\_  
該当資料なし

(4) クリアランス \_\_\_\_\_  
該当資料なし

(5) 分布容積 \_\_\_\_\_  
該当資料なし

(6) その他 \_\_\_\_\_  
該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析 \_\_\_\_\_

(1) 解析方法 \_\_\_\_\_  
該当資料なし

(2) パラメータ変動要因 \_\_\_\_\_  
該当資料なし

4. 吸収 \_\_\_\_\_

(参考) [ラット、イヌ]

ラットとイヌに [ $^{14}\text{C}$ ] ボグリボースを経口及び静脈内投与したときの  $^{14}\text{C}$  の尿中排泄率の比から、ボグリボースの吸収率はラットで 5.9%、イヌで 2.7%と極めて低かった<sup>13)</sup>。

## 5. 分布

### (1) 血液－脳関門通過性

(参考) [ラット]

移行しにくい (VII. 5 (5) の項参照)。

### (2) 血液－胎盤関門通過性

(参考) [ラット]

妊娠20日目のラットに $^{14}\text{C}$ ボグリボース 1mg/kg を経口投与すると、 $^{14}\text{C}$ は胎児に移行したが、胎児血漿中と組織内の濃度はいずれの時点でも母動物の血漿中濃度よりも低かった。 $^{14}\text{C}$ は羊水中にも検出されたが、その濃度は胎盤中の濃度よりも低いことから、胎児への移行は主として胎盤を介して行われると考えられた<sup>13)</sup>。

#### ■ $^{14}\text{C}$ ボグリボース経口投与時の胎児への移行

投与後の 時間	濃 度 (ng/mL or ng/g)				
	母動物血漿	胎 盤	羊 水	胎児血漿	胎児組織
1	35.9±8.4	8.9±1.8	0.3±0.1	0.8±0.2	1.0±0.1
4	30.7±1.4	9.0±0.7	1.9±0.6	2.1±0.4	1.9±0.2
8	15.2±2.9	5.7±2.1	1.0±0.3	1.2±0.3	2.0±0.1

mean±SD、n=3

### (3) 乳汁への移行性

(参考) [ラット]

出産15日目のラットに $^{14}\text{C}$ ボグリボース 1mg/kg を経口投与すると、 $^{14}\text{C}$ は乳汁中へ移行したが、その濃度は血漿中濃度に比べて低かった<sup>13)</sup>。

#### ■ $^{14}\text{C}$ ボグリボース経口投与時の乳汁中への移行

投与後の 時間	濃 度 (ng/mL)	
	血 漿	乳 汁
1	19.5±4.3	3.3±0.7
4	15.0±1.7	5.7±2.0
8	9.2±1.6	5.6±1.9

mean±SD、n=4

### (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) [ラット]

ラットに [<sup>14</sup>C] ボグリボース 1mg/kg を経口投与すると、<sup>14</sup>C は投与 15 分で各組織に移行し、それらの濃度は多くの組織で 1 時間後にピークとなった。各組織内の濃度は消化管と比べて極めて低く、これはボグリボースの吸収率が小さいためと考えられた。ピーク時点における濃度は胃壁で最も高く、ついで腸壁、腎臓、甲状腺、下垂体、血漿、肝臓の順であり、脳で最も低かった<sup>13)</sup>。

■ [<sup>14</sup>C] ボグリボース経口投与時の各組織内への移行

組 織	濃 度 (ng/mL or ng/g)					
	15分	1時間	4時間	8時間	24時間	72時間
血 漿	10±3	18±2	9±1	6±0	3±1	2±0
脳	1±1	1±0	<1	<1	<1	1±0
脊 髓	4±3	2±0	1±0	1±0	1±0	1±1
下 垂 体	48±8	39±4	21±6	22±8	21±5	23±3
眼 球	2±1	3±1	1±1	1±0	1±0	1±0
ハーダー腺	6±3	4±0	2±1	4±1	3±1	2±0
顎 下 腺	2±1	4±1	2±0	2±0	1±0	1±1
甲 状 腺	98±40	41±10	21±3	25±6	20±7	31±4
胸 腺	1±0	2±0	1±1	1±0	1±0	1±0
心 臓	2±1	3±0	1±1	1±0	1±0	1±0
肺	3*(2,3)	7±2	3±1	3±1	2±0	2±1
肝 臓	11±5	14±2	9±1	8±1	4±1	2±1
脾 臓	2±1	3±1	2±0	2±0	2±0	2±1
膵 臓	2±0	2±0	1±1	1±0	1±0	<1
副 腎	7±2	9±2	6±2	4±1	4±1	3±2
腎 臓	71±28	422±11	323±17	228±17	106±24	21±2
精 巢	1±0	2±0	1±0	1±0	1±0	1±0
骨 格 筋	1±1	2±0	1±0	1±0	1±0	1±0
脂肪組織	4±1	6±3	4±1	2±0	3±1	3±1
胃 壁	2919±669	414±125	224±158	85±80	12±2	1±0
腸 壁	719±129	1446±112	746±131	506±122	71±39	3±1

mean±SD、n=3、\* : 2例の平均値、( ) 内は個別データ

## (6) 血漿蛋白結合率

(参考) [in vitro]

ラット、イヌの血漿、ヒトの血清及び5%ヒト血清アルブミン溶液に *in vitro* で添加した [<sup>14</sup>C] ボグリボースの蛋白結合率は下表のとおりであった (超遠心法)<sup>13)</sup>。

### ■ [<sup>14</sup>C] ボグリボースのラット、イヌ、ヒトにおける蛋白結合率

血漿中濃度 (ng/mL)	結 合 率 (%)			
	ラット	イヌ	ヒト*	ヒト血清アルブミン**
5	14	90	1	12
50	11	77	4	7
500	7	23	7	6

\* : 血清、\*\* : 5% 溶液

## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

(参考) [ラット、イヌ]

ラット及びイヌに [<sup>14</sup>C] ボグリボース 1mg/kg を経口投与して、血漿、排泄物中の未変化体とその他の成分を薄層クロマトグラフィーにより調べた結果、ボグリボースは体内でほとんど代謝されず、大部分は未変化体として尿、糞中に排泄されることが明らかになった。ボグリボースの吸収率は低く、また、血漿と排泄物中では大部分が未変化体であったことから、他の成分については検討しなかった<sup>13)</sup>。

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当しない

## 7. 排泄

### 排泄部位及び経路

健康成人男性 6 例に、ボグリボース 1 回 0.2mg 1 日 3 回毎食直前に 7 日間経口投与したとき、また、健康成人男性 10 例に、ボグリボース 1 回 2mg を食直前に経口投与したとき、いずれも尿中にボグリボースは検出されなかった (検出限界 20ng/mL) ことから、主に糞便中に排泄されると考えられた<sup>12)</sup>。

## 排泄率

[海外データ]

健康成人男性 6 例に、ボグリボース 1 回 80mg を食直前に単回投与したとき、投与 48 時間後までの尿中排泄率は投与量の 0.63%～1.70%であった。

(バイスン錠承認時資料：1994 年 7 月)

(参考) [ラット、イヌ]

ラット及びイヌに [<sup>14</sup>C] ボグリボース 1mg/kg を経口投与すると、ラットでは 72 時間で排泄はほぼ終了し、投与した <sup>14</sup>C の 5% が尿に、97.5% が糞中に排泄された。呼気への排泄はみられなかった (< 0.1%)。イヌでも 72 時間でほぼ終了し、尿、糞への排泄はそれぞれ 2.7% と 93.5% であった。静脈内投与した場合、<sup>14</sup>C の排泄は 72 時間でほぼ終了し、ラット、イヌの尿への排泄率はそれぞれ 84.9% と 99.4% であった。したがって、経口投与後に吸収された薬物は主に尿へ排出され、未吸収の薬物は糞に排泄されることが考えられた<sup>13)</sup>。

### ■単回経口投与時の 24 時間累積尿中排泄率 (%)

動物	投与経路	時間	累積排泄率 (投与量に対する%)		総排泄率 (投与量に対する%)
			尿	糞	
ラット	経口	4	1.4±0.3	ND	ND
		8	3.7±1.2	ND	ND
		24	4.8±1.0	82.3±11.4	87.1±12.4
		48	5.0±0.9	97.1±0.2	102.1±1.1
		72	5.0±0.9	97.5±0.1	102.6±1.0
		96	5.0±0.9	97.6±0.1	102.6±0.9
	静脈内	4	80.8±3.2	ND	ND
		8	82.2±2.0	ND	ND
		24	83.9±2.3	5.4±2.3	89.3±0.9
		48	84.6±2.3	10.4±1.2	95.0±1.2
		72	84.9±2.3	11.6±1.0	96.5±1.6
		96	85.0±2.3	11.9±1.1	96.9±1.5
イヌ	経口	4	0.6±0.6	ND	ND
		8	0.7±0.6	ND	ND
		24	2.3±0.4	86.2±6.1	88.4±6.5
		48	2.6±0.5	92.5±2.0	95.1±2.5
		72	2.7±0.5	93.5±1.7	96.2±2.2
		96	2.7±0.6	93.7±1.7	96.4±2.2
	静脈内	4	79.8±11.1	ND	ND
		8	90.3±3.5	ND	ND
		24	96.8±1.0	0.3±0.1	97.0±1.0
		48	98.6±0.9	0.6±0.1	99.2±0.9
		72	99.4±0.9	0.8±0.1	100.2±0.9
		96	99.6±0.9	0.8±0.1	100.5±0.9

mean±SD、n=3、ND：測定せず

8. トランスポーターに関する情報 

---

該当資料なし

9. 透析等による除去率 

---

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者 

---

該当資料なし

11. その他 

---

該当しない

## 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

設定されていない

### 2. 禁忌内容とその理由

#### 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 重症ケトーシス、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。]

2.2 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。]

2.3 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注意とその理由

「V. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8. 重要な基本的注意

##### 〈効能共通〉

8.1 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。[11.1.1 参照]

8.2 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。[11.1.1 参照]

##### 〈糖尿病の食後過血糖の改善〉

8.3 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（錠0.2、OD錠0.2のみ）〉

8.4 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。

## 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

### (1) 合併症・既往歴等のある患者

#### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

##### 9.1.1 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。[11.1.2 参照]

##### 9.1.2 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。

##### 9.1.3 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。

### (2) 腎機能障害患者

#### 9.2 腎機能障害患者

##### 9.2.1 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のおそれがある。

### (3) 肝機能障害患者

#### 9.3 肝機能障害患者

##### 9.3.1 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のおそれがある。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。[11.1.4 参照]

### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

### (5) 妊婦

#### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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<sup>1), 2)</sup>。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

一般に高齢者では生理機能が低下している。[7. 参照]

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
糖尿病用薬 スルホニルアミド系及び スルホニルウレア系薬剤 ビグアナイド系薬剤 インスリン製剤 インスリン抵抗性改善剤 [11.1.1参照]	インスリン及びスルホニルウレア系薬剤と併用した際に、低血糖発現の報告があるので、左記薬剤との併用時には、低血糖発現の可能性を考慮し、低用量から投与を開始するなど慎重に投与すること。	左記糖尿病用薬の血糖降下作用に本剤の糖質吸収遅延作用が加わる。
糖尿病用薬及びその血糖降下作用を増強又は減弱する薬剤を併用している場合 糖尿病用薬の血糖降下作用を増強する薬剤 β-遮断剤 サリチル酸剤 モノアミン酸化酵素阻害剤 フィブラート系の高脂血症治療剤 ワルファリン等 糖尿病用薬の血糖降下作用を減弱する薬剤 アドレナリン 副腎皮質ホルモン 甲状腺ホルモン等	左記の併用に加え更に本剤を併用する場合には、糖尿病用薬の使用上の注意に記載の相互作用に留意するとともに、本剤の糖質吸収遅延作用が加わることによる影響に十分注意すること。	左記薬剤により他の糖尿病用薬の血糖降下作用が増強又は減弱されるところに、本剤の糖質吸収遅延作用が加わる。

## 8. 副作用

### 11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

#### (1) 重大な副作用と初期症状

##### 11.1 重大な副作用

###### 11.1.1 低血糖（他の糖尿病用薬との併用の場合 0.1～5%未満、併用しない場合頻度不明）

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を投与するなど適切な処置を行うこと。[7.、8.1、8.2、10.2 参照]

###### 11.1.2 腸閉塞（頻度不明）

腹部膨満、鼓腸、放屁増加等があらわれ、腸内ガス等の増加により、腸閉塞があらわれることがある。観察を十分に行い、持続する腹痛、嘔吐等の症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。[7.、9.1.1 参照]

###### 11.1.3 劇症肝炎、重篤な肝機能障害、黄疸（頻度不明）

劇症肝炎、AST、ALTの上昇等を伴う重篤な肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

###### 11.1.4 意識障害を伴う高アンモニア血症（頻度不明）

重篤な肝硬変例に投与した場合、便秘等を契機として高アンモニア血症が増悪し、意識障害を伴うことがあるので、排便状況等を十分に観察し、異常が認められた場合には直ちに投与を中止すること。[9.3.1 参照]

#### (2) その他の副作用

##### 11.2 その他の副作用

	5%以上	0.1～5%未満	0.1%未満	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			発疹、そう痒、光線過敏症	
肝臓		AST、ALT、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		

■副作用頻度一覧表等

◇糖尿病の食後過血糖の改善

■副作用の発現状況

	承認時までの試験	製造販売後の調査	合計
調査施設数	320	1,312	1,632
調査症例数	965	4,446	5,411
副作用の発現症例数	154	460	614
副作用の発現件数	287	767	1,054
副作用の発現症例率(%)	16.0	10.3	11.3

■副作用の種類別発現頻度

副作用の種類	副作用の発現件数(%)			副作用の種類	副作用の発現件数(%)		
	承認時までの試験	製造販売後の調査	合計		承認時までの試験	製造販売後の調査	合計
皮膚・皮膚付属器障害	0	14 (0.31)	14 (0.26)	手指しびれ(感)	0	1 (0.02)	1 (0.02)
紅斑	0	1 (0.02)	1 (0.02)	めまい	0	5 (0.11)	5 (0.09)
蕁麻疹	0	2 (0.04)	2 (0.04)	ふらつき(感)	0	8 (0.18)	8 (0.15)
痒痒(症)	0	1 (0.02)	1 (0.02)	ふらふら(感)	0	2 (0.04)	2 (0.04)
かゆみ	0	1 (0.02)	1 (0.02)	めまい感	0	2 (0.04)	2 (0.04)
痒痒感	0	2 (0.04)	2 (0.04)	ふわふわ感	0	1 (0.02)	1 (0.02)
皮膚痒痒症	0	1 (0.02)	1 (0.02)	自律神経系障害	1 (0.10)	8 (0.18)	9 (0.17)
脱毛(症)	0	1 (0.02)	1 (0.02)	発汗	1 (0.10)	4 (0.09)	5 (0.09)
小丘疹	0	1 (0.02)	1 (0.02)	冷汗	0	5 (0.11)	5 (0.09)
発疹	0	4 (0.09)	4 (0.07)	視覚障害	2 (0.21)	3 (0.07)	5 (0.09)
痒疹	0	1 (0.02)	1 (0.02)	眼のしょぼしょぼ(感)	0	1 (0.02)	1 (0.02)
色素沈着	0	1 (0.02)	1 (0.02)	視力障害	0	1 (0.02)	1 (0.02)
固定(薬)疹	0	1 (0.02)	1 (0.02)	眼の乾燥感	1 (0.10)	0	1 (0.02)
毛包炎(毛嚢炎)	0	1 (0.02)	1 (0.02)	眼のちらつき	1 (0.10)	1 (0.02)	2 (0.04)
筋・骨格系障害	0	1 (0.02)	1 (0.02)	その他の特殊感覚障害	0	2 (0.04)	2 (0.04)
筋肉痛	0	1 (0.02)	1 (0.02)	苦味	0	1 (0.02)	1 (0.02)
中枢・末梢神経系障害	2 (0.21)	31 (0.70)	33 (0.61)	味覚異常	0	1 (0.02)	1 (0.02)
眩暈	0	2 (0.04)	2 (0.04)	精神障害	0	4 (0.09)	4 (0.07)
意識喪失	0	2 (0.04)	2 (0.04)	無気力	0	1 (0.02)	1 (0.02)
意識障害	0	3 (0.07)	3 (0.06)	嗜眠	0	1 (0.02)	1 (0.02)
部分的意識喪失	0	1 (0.02)	1 (0.02)	眠気	0	2 (0.04)	2 (0.04)
酩酊感	1 (0.10)	0	1 (0.02)	消化管障害	95 (9.84)	345 (7.76)	440 (8.13)
手指振戦	0	1 (0.02)	1 (0.02)	イレウス	0	3 (0.07)	3 (0.06)
ふるえ	0	1 (0.02)	1 (0.02)	嘔気	4 (0.41)	8 (0.18)	12 (0.22)
頭痛	1 (0.10)	5 (0.11)	6 (0.11)	悪心	3 (0.31)	9 (0.20)	12 (0.22)
頭重(感)	0	2 (0.04)	2 (0.04)	嘔吐	4 (0.41)	10 (0.22)	14 (0.26)
舌しびれ	0	1 (0.02)	1 (0.02)	ゲップ	0	2 (0.04)	2 (0.04)
しびれ(感)	0	1 (0.02)	1 (0.02)	下痢	39 (4.04)	57 (1.28)	96 (1.77)

副作用の種類	副作用の発現件数(%)			副作用の種類	副作用の発現件数(%)		
	承認時までの試験	製造販売後の調査	合計		承認時までの試験	製造販売後の調査	合計
軟便	15(1.55)	14(0.31)	29(0.54)	低血糖	0	13(0.29)	13(0.24)
口内炎	0	1(0.02)	1(0.02)	低血糖性反応	0	9(0.20)	9(0.17)
痔核	0	1(0.02)	1(0.02)	血清総蛋白減少	1(0.10)	0	1(0.02)
胃膨満	0	1(0.02)	1(0.02)	尿糖陽性	1(0.10)	0	1(0.02)
胃もたれ感	0	2(0.04)	2(0.04)	血清アマラーゼ上昇	1(0.10)	2(0.04)	3(0.06)
心窩部膨満感	0	1(0.02)	1(0.02)	トリグリセライド低下	0	1(0.02)	1(0.02)
呑酸	0	1(0.02)	1(0.02)	血清アルブミン低下	2(0.21)	0	2(0.04)
胸やけ	0	2(0.04)	2(0.04)	高アンモニア血症	0	1(0.02)	1(0.02)
空腹感	1(0.10)	2(0.04)	3(0.06)	高トリグリセライド血症	0	1(0.02)	1(0.02)
食欲不振	3(0.31)	5(0.11)	8(0.15)	HDL低下	0	1(0.02)	1(0.02)
食欲減退	0	2(0.04)	2(0.04)	HDLコレステロール低下	1(0.10)	2(0.04)	3(0.06)
腹痛	11(1.14)	20(0.45)	31(0.57)	心・血管障害(一般)	0	1(0.02)	1(0.02)
胃圧迫感	1(0.10)	0	1(0.02)	顔面蒼白	0	1(0.02)	1(0.02)
胃不快感	1(0.10)	5(0.11)	6(0.11)	心拍数・心リズム障害	0	2(0.04)	2(0.04)
胃痛	1(0.10)	2(0.04)	3(0.06)	動悸	0	2(0.04)	2(0.04)
胃部刺激感	1(0.10)	0	1(0.02)	赤血球障害	2(0.21)	7(0.16)	9(0.17)
心窩部不快感	1(0.10)	1(0.02)	2(0.04)	悪性貧血	0	1(0.02)	1(0.02)
腹部不快感	1(0.10)	8(0.18)	9(0.17)	貧血	0	2(0.04)	2(0.04)
心窩部痛	1(0.10)	0	1(0.02)	赤血球減少	1(0.10)	7(0.16)	8(0.15)
上腹部異和感	0	1(0.02)	1(0.02)	ヘマトクリット値減少	2(0.21)	4(0.09)	6(0.11)
便秘	5(0.52)	34(0.76)	39(0.72)	ヘモグロビン減少	0	2(0.04)	2(0.04)
鼓腸放屁	0	1(0.02)	1(0.02)	白血球・網内系障害	7(0.73)	3(0.07)	10(0.18)
鼓腸	0	2(0.04)	2(0.04)	好酸球増多(症)	0	2(0.04)	2(0.04)
腸管内ガス発生	0	1(0.02)	1(0.02)	白血球減少(症)	1(0.10)	1(0.02)	2(0.04)
腹部膨満	0	90(2.02)	90(1.66)	白血球増多(症)	6(0.62)	0	6(0.11)
腹部膨満感	34(3.52)	62(1.39)	96(1.77)	血小板・出血凝血障害	1(0.10)	3(0.07)	4(0.07)
腹鳴	20(2.07)	17(0.38)	37(0.68)	血小板減少(症)	1(0.10)	3(0.07)	4(0.07)
放屁増加	39(4.04)	118(2.65)	157(2.90)	泌尿器系障害	15(1.55)	4(0.09)	19(0.35)
下血	0	1(0.02)	1(0.02)	血中クレアチニン上昇	0	1(0.02)	1(0.02)
排便回数増加	0	3(0.07)	3(0.06)	尿蛋白陽性	5(0.52)	0	5(0.09)
痔出血	0	1(0.02)	1(0.02)	尿検査異常	3(0.31)	0	3(0.06)
便意	0	2(0.04)	2(0.04)	BUN上昇	9(0.93)	2(0.04)	11(0.20)
残便感	0	1(0.02)	1(0.02)	排尿頻回	0	1(0.02)	1(0.02)
胃腸症状	0	1(0.02)	1(0.02)	頻尿	0	1(0.02)	1(0.02)
便異常	0	1(0.02)	1(0.02)	一般的全身障害	0	22(0.49)	22(0.41)
肝臓・胆管系障害	32(3.32)	53(1.19)	85(1.57)	悪寒	0	1(0.02)	1(0.02)
AL-P上昇	2(0.21)	10(0.22)	12(0.22)	眼瞼浮腫	0	1(0.02)	1(0.02)
血清LDH上昇	10(1.04)	7(0.16)	17(0.31)	四肢疼痛	0	1(0.02)	1(0.02)
血清AST(GOT)上昇	15(1.55)	31(0.70)	46(0.85)	背部不快感	0	1(0.02)	1(0.02)
血清ALT(GPT)上昇	22(2.28)	46(1.03)	68(1.26)	気分不良	0	6(0.13)	6(0.11)
血清ビリルビン上昇	1(0.10)	1(0.02)	2(0.04)	全身倦怠(感)	0	3(0.07)	3(0.06)
γ-GTP上昇	6(0.62)	11(0.25)	17(0.31)	不快感	0	2(0.04)	2(0.04)
代謝・栄養障害	12(1.24)	33(0.74)	45(0.83)	浮腫	0	1(0.02)	1(0.02)
口渇	1(0.10)	0	1(0.02)	下肢脱力感	0	1(0.02)	1(0.02)
ケトン尿症	0	1(0.02)	1(0.02)	脱力(感)	0	4(0.09)	4(0.07)
高カルシウム血症	6(0.62)	1(0.02)	7(0.13)	だるさ	0	5(0.11)	5(0.09)
高カルシウム血症	0	1(0.02)	1(0.02)	抵抗機構障害	0	1(0.02)	1(0.02)
高コレステロール血症	0	3(0.07)	3(0.06)	憩室炎	0	1(0.02)	1(0.02)

承認時までの試験集計：1994年7月  
製造販売後の調査集計：2000年9月

◇耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制

■副作用の発現状況

	承認時までの状況	特定使用成績調査	合計
調査施設数	120	124	244
調査症例数	951	713	1,664
副作用等の発現症例数	452	55	507
副作用等の発現件数	779	69	848
副作用等の発現症例率(%)	47.53	7.71	30.47

■副作用の種類別発現頻度

副作用等の種類別発現症例(件数)率(%)				副作用等の種類別発現症例(件数)率(%)			
副作用等の種類	承認時までの状況	特定使用成績調査	合計	副作用等の種類	承認時までの状況	特定使用成績調査	合計
良性、悪性および詳細不明の新生物(嚢胞およびポリープを含む)	1(0.11)	0	1(0.06)	あくび	1(0.11)	0	1(0.06)
小腸癌	1(0.11)	0	1(0.06)	横隔膜痛	1(0.11)	0	1(0.06)
直腸新生物	1(0.11)	0	1(0.06)	胃腸障害	384(40.38)	38(5.33)	422(25.36)
代謝および栄養障害	10(1.05)	2(0.28)	12(0.72)	裂孔ヘルニア	1(0.11)	0	1(0.06)
食欲減退	1(0.11)	1(0.14)	2(0.12)	膣径ヘルニア	1(0.11)	0	1(0.06)
高コレステロール血症	0	1(0.14)	1(0.06)	腸憩室	1(0.11)	0	1(0.06)
低血糖症	9(0.95)	0	9(0.54)	口腔嚢胞	1(0.11)	0	1(0.06)
精神障害	4(0.42)	0	4(0.24)	大腸ポリープ	2(0.21)	0	2(0.12)
不快気分	2(0.21)	0	2(0.12)	胃腸障害	1(0.11)	0	1(0.06)
不眠症	2(0.21)	0	2(0.12)	大腸炎	1(0.11)	0	1(0.06)
神経系障害	17(1.79)	2(0.28)	19(1.14)	腸炎	1(0.11)	0	1(0.06)
くも膜下出血	1(0.11)	0	1(0.06)	胃炎	4(0.42)	0	4(0.24)
第3脳神経麻痺	1(0.11)	0	1(0.06)	便秘	41(4.31)	6(0.84)	47(2.82)
頭痛	2(0.21)	2(0.28)	4(0.24)	便意切迫	1(0.11)	0	1(0.06)
振戦	1(0.11)	0	1(0.06)	下痢	126(13.25)	13(1.82)	139(8.35)
浮動性めまい	11(1.16)	0	11(0.66)	排便回数増加	4(0.42)	0	4(0.24)
体位性めまい	2(0.21)	0	2(0.12)	排便障害	4(0.42)	0	4(0.24)
傾眠	1(0.11)	0	1(0.06)	消化管運動障害	1(0.11)	0	1(0.06)
眼障害	3(0.32)	0	3(0.18)	腹部不快感	16(1.68)	2(0.28)	18(1.08)
眼瞼そう痒症	1(0.11)	0	1(0.06)	腹部膨満	125(13.14)	14(1.96)	139(8.35)
眼瞼炎	1(0.11)	0	1(0.06)	腹痛	12(1.26)	1(0.14)	13(0.78)
霧視	1(0.11)	0	1(0.06)	下腹部痛	1(0.11)	0	1(0.06)
耳および迷路障害	5(0.53)	0	5(0.30)	上腹部痛	4(0.42)	1(0.14)	5(0.30)
耳鳴	3(0.32)	0	3(0.18)	消化不良	3(0.32)	1(0.14)	4(0.24)
回転性めまい	1(0.11)	0	1(0.06)	変色便	1(0.11)	0	1(0.06)
迷路性回転性めまい	1(0.11)	0	1(0.06)	硬便	6(0.63)	0	6(0.36)
心臓障害	4(0.42)	0	4(0.24)	鼓腸	167(17.56)	7(0.98)	174(10.46)
期外収縮	1(0.11)	0	1(0.06)	悪心	9(0.95)	1(0.14)	10(0.60)
上室性期外収縮	1(0.11)	0	1(0.06)	嘔吐	1(0.11)	0	1(0.06)
動悸	2(0.21)	0	2(0.12)	心窩部不快感	1(0.11)	0	1(0.06)
血管障害	2(0.21)	0	2(0.12)	腹部症状	1(0.11)	0	1(0.06)
ほてり	1(0.11)	0	1(0.06)	胃腸音異常	43(4.52)	1(0.14)	44(2.64)
高血圧	1(0.11)	0	1(0.06)	十二指腸潰瘍	1(0.11)	0	1(0.06)
呼吸器、胸郭および縦隔障害	4(0.42)	0	4(0.24)	びらん性胃炎	1(0.11)	0	1(0.06)
喘息	1(0.11)	0	1(0.06)	痔核	2(0.21)	0	2(0.12)
咳嗽	1(0.11)	0	1(0.06)	口内炎	1(0.11)	1(0.14)	2(0.12)
				舌乾燥	1(0.11)	0	1(0.06)
				歯周病	1(0.11)	0	1(0.06)

副作用等の種類別発現症例(件数)率(%)				副作用等の種類別発現症例(件数)率(%)			
副作用等の種類	承認時までの状況	特定使用成績調査	合計	副作用等の種類	承認時までの状況	特定使用成績調査	合計
肝胆道系障害	3(0.32)	8(1.12)	11(0.66)	臨床検査	69(7.26)	3(0.42)	72(4.33)
胆嚢炎	1(0.11)	0	1(0.06)	血圧低下	1(0.11)	0	1(0.06)
肝機能異常	0	7(0.98)	7(0.42)	拡張期血圧上昇	1(0.11)	0	1(0.06)
脂肪肝	1(0.11)	0	1(0.06)	血中クレアチンホスホキナーゼ増加	12(1.26)	0	12(0.72)
高ビリルビン血症	0	1(0.14)	1(0.06)	血中乳酸脱水素酵素増加	3(0.32)	0	3(0.18)
肝障害	1(0.11)	0	1(0.06)	血中アルカリホスファターゼ増加	4(0.42)	1(0.14)	5(0.30)
皮膚および皮下組織障害	5(0.53)	2(0.28)	7(0.42)	ヘモグロビン減少	1(0.11)	0	1(0.06)
蕁麻疹	1(0.11)	0	1(0.06)	赤血球数減少	1(0.11)	0	1(0.06)
接触性皮膚炎	1(0.11)	0	1(0.06)	白血球数減少	1(0.11)	0	1(0.06)
湿疹	2(0.21)	0	2(0.12)	白血球数増加	1(0.11)	0	1(0.06)
掻痒症	0	2(0.28)	2(0.12)	血小板数増加	1(0.11)	0	1(0.06)
発疹	2(0.21)	1(0.14)	3(0.18)	アラニンアミノトランスフェラーゼ増加	33(3.47)	0	33(1.98)
筋骨格系および結合組織障害	1(0.11)	1(0.14)	2(0.12)	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ増加	21(2.21)	0	21(1.26)
関節周囲炎	1(0.11)	0	1(0.06)	血中ビリルビン増加	2(0.21)	0	2(0.12)
筋肉痛	0	1(0.14)	1(0.06)	γ-グルタミルトランスフェラーゼ増加	16(1.68)	1(0.14)	17(1.02)
腎および尿路障害	1(0.11)	0	1(0.06)	血中尿酸増加	3(0.32)	0	3(0.18)
腎結石症	1(0.11)	0	1(0.06)	尿中ケトン体陽性	2(0.21)	0	2(0.12)
一般・全身障害および投与部位の状態	16(1.68)	2(0.28)	18(1.08)	血中アルブミン減少	1(0.11)	0	1(0.06)
無力症	1(0.11)	0	1(0.06)	総蛋白増加	1(0.11)	0	1(0.06)
胸部不快感	1(0.11)	0	1(0.06)	血中尿素増加	1(0.11)	0	1(0.06)
胸痛	2(0.21)	0	2(0.12)	尿中蛋白陽性	3(0.32)	0	3(0.18)
不快感	1(0.11)	0	1(0.06)	血中カリウム増加	1(0.11)	0	1(0.06)
異常感	3(0.32)	0	3(0.18)	体重減少	0	1(0.14)	1(0.06)
空腹	2(0.21)	1(0.14)	3(0.18)	体重増加	1(0.11)	0	1(0.06)
倦怠感	5(0.53)	1(0.14)	6(0.36)				
口渇	2(0.21)	0	2(0.12)				

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

## 10. 過量投与

設定されていない

## 11. 適用上の注意

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 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ある。

#### (OD錠のみ)

14.1.2 本剤は舌の上のせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

12. その他の注意 

---

(1) 臨床使用に基づく情報 

---

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報 

---

設定されていない

## Ⅹ：非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

---

#### (1) 薬効薬理試験

---

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照

#### (2) 安全性薬理試験

---

ボグリボースの一般薬理作用をマウス、ラット、モルモット、ウサギ及びネコを用いて検討した。ボグリボースは、100mg/kg (i.v.) でも、マウスの一般症状観察において、極めて軽度の筋緊張の低下を示したにすぎなかった。また、マウスの自発運動量及び協調運動及びラットの正常体温にも無影響であり、マウスの抗痙攣作用、睡眠増強作用及び鎮痛作用も示さなかった。さらに、無麻酔無拘束ネコ (100mg/kg, i.v.) の自発脳波及び行動、麻酔ネコの脊髄反射 (100mg/kg, i.v.)、摘出ラットの横隔神経・筋標本 ( $10^{-4}$ M) における神経-筋接合部に対しても作用を示さなかった。

麻酔ネコの呼吸運動、全身血圧、心拍数及び心電図に対して、ボグリボースは、100mg/kg (i.v.) でも影響を及ぼさなかった。麻酔イヌの血圧、心拍数及び末梢血流量に対して、100mg/kg (i.v.) の用量でも明らかな作用を示さなかった。モルモットの摘出心房標本に対して、 $10^{-4}$ M の濃度でも無影響であった。

ボグリボース (100mg/kg, i.v.) は、麻酔ネコの自律神経系に対して作用を示さなかった。また、モルモット回腸の各種 agonist 収縮に対しても作用を示さなかった。

ボグリボース (10 ~ 100mg/kg, i.v.) は、ラットの腎機能及び消化器系に対しても作用を示さなかった。

ボグリボースは、摘出平滑筋標本において、高濃度 ( $10^{-4}$ M) でも、ウサギ回腸及びラットの妊娠子宮の自動運動に対して作用を示さなかった。

以上、ボグリボースは、今回検討した系において特定の薬理作用を示さないものと考えられる<sup>14)</sup>。

#### (3) 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)

投与経路	動物種	マウス		ラット		イヌ
		♂	♀	♂	♀	♂
経口		14.7~21.5	14.7~21.5	約20	約22.5	2以上

(武田薬品・研究所)

### (2) 反復投与毒性試験

動物種	投与期間	投与経路	投与量 (mg/kg/日)	無影響量 (mg/kg/日)
ラット	5週間*	経口	30, 100, 300	30
	13週間 <sup>15)</sup>	経口	10, 30, 100	<10
	1年間 <sup>16)</sup>	経口	3, 10, 30, 100	3
イヌ	4週間*	経口	30, 100, 300, 1000	300
	13週間 <sup>17)</sup>	経口	30, 100, 300	<30
	1年間 <sup>18)</sup>	経口	1, 3, 10, 30	10

ラット及びイヌに共通して、下痢若しくは軟便及び体重の低下又は増加抑制がみられた。ラットではさらに腎臓の石灰沈着、副腎皮質の過形成がみられた。これらの所見は難吸収性又は難消化性炭水化物を投与したラットにおいても見られることが報告されており、本剤の直接作用によるものではなく、薬理作用に起因した二次的变化と考えられる。

\*：武田薬品・研究所

### (3) 遺伝毒性試験

細菌による復帰変異試験、培養細胞による染色体異常試験及びマウス小核試験において変異原性は認められていない<sup>19)</sup>。

### (4) がん原性試験

マウス<sup>20)</sup>に15、50、150mg/kg/日を雄に19カ月間、雌に24カ月間並びにラット<sup>21)</sup>の雌雄に3、10、30mg/kg/日を24カ月間経口投与した試験ではがん原性は認められていない。

(5) 生殖発生毒性試験

	動物種	投与量 (mg/kg/日)	無影響量 (mg/kg/日)	
			親動物	胎児、出生児
妊娠前・妊娠期及び授乳期投与試験 <sup>22)</sup>	ラット	10、30、100	30	< 10
器官形成期投与試験 <sup>23)</sup>	ラット	100、300、900	100	100
器官形成期投与試験 <sup>24)</sup>	ウサギ	100、300、1000	100	100
周産期及び授乳期投与試験 <sup>25)</sup>	ラット	30、100、300	30	< 30

(投与経路は経口)

親動物の観察では、各試験で下痢若しくは軟便及び体重増加の抑制がみられた。また、ラットの妊娠前・妊娠期及び授乳期投与試験の 100mg/kg 群で死亡がみられ、ウサギの器官形成期投与試験の 1,000mg/kg 群で流産（早産）及び死亡がみられた。しかし、性周期、交尾率、受胎率、黄体数、着床数、妊娠期間、分娩状態及び生殖器の肉眼観察では、ラット及びウサギを用いたいずれの試験においても投薬の影響はみられていない。

胎児の観察では、ラットの器官形成期投与試験の 300mg/kg 以上の群において体重の低下と低体重に伴ったと考えられる内臓あるいは骨格変異の増加傾向が認められ、ウサギの器官形成期投与試験では、300mg/kg 以上の群において死亡率が高い傾向を示したが、ラット及びウサギを用いたいずれの試験においても催奇形作用は認められていない。

出生児の観察では、生存率の低下及び体重増加の抑制がみられた。これらの所見はグルコース食を与えると認められなくなることから、本薬の母動物に対する薬効発現の二次的影響であると考えられる。ラットを用いたいずれの試験においても行動及び生殖機能に投薬の影響は認められていない。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

マウス及びモルモットを用いた試験では抗原性は認められていない<sup>26)</sup>。

## X：管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：該当しない

### 2. 有効期間

有効期間：3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

< OD錠の場合 >

#### 20. 取扱い上の注意

開封後も湿気を避けて保存すること。本品は高防湿性の内袋により品質保持をはかっている。

「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照

### 5. 患者向け資料

- ・患者向医薬品ガイド：有り
- ・くすりのしおり：有り
- ・患者向指導箋：有り

<表面>

パイスン錠・OD錠を服用される患者さんへ

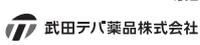
<パイスン錠>      <パイスンOD錠>



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。**  
炭水化物をブドウ糖に分解する酵素を阻害し、糖の吸収を遅らせる薬ですので、**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) 低血糖症状があらわれることがあります。**
  - ・この薬とほかの糖尿病の薬(血糖を下げる薬)を併用した場合に、低血糖症状があらわれることがあります。
  - ・また、ほかの糖尿病の薬を併用していない場合でも、低血糖症状があらわれることがあります。
  - ・この薬は糖分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、低血糖症状があらわれると事故につながるおそれがあります。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。**  
(裏面もご確認ください)

 武田テバ薬品株式会社

<裏面>

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、急に強い空腹感、動悸、力のぬけた感じ、冷汗、手足のふるえ、眠のちらつき等が起こります。また頭痛がったり、ぼんやりしたり、ふらついたり、いつもと人柄が違ったような異常な行動をとることもあります。  
ひどい場合には、けいれんを起こしたり意識を失うこともあります。  
低血糖は、空腹時に起こり、食べ物をとると良くなるのが特徴です。

脱力感・異常な空腹感      冷汗・動悸      手足のふるえ      言語が遅い・めまい      意識を失う

- 低血糖症状があらわれたら**
  - ・低血糖症状があらわれたら危険な状態ですから、軽いうちに治さなければなりません。軽いうちはブドウ糖をとると治るので、**日頃からブドウ糖を持ち歩き**、低血糖症状があらわれたときは、すぐその場で**10gのブドウ糖**をとってください。
  - ・低血糖症状があらわれた場合は、必ず早めに主治医に報告してください。
- 低血糖を起こさないために**
  - ・薬の量や飲み方は主治医の指導を守りましょう。
  - ・食事療法、運動療法はきちんと守りましょう。
  - ・食事時刻の遅れ、食事量または炭水化物の摂取が少ない食事、激しい運動をする場合には注意しましょう。

医療機関名

SDN161018-0000

※改訂されることがあります。最新の内容は弊社ウェブサイト (<https://www.med.takeda-teva.com>) をご参照ください。

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：各種後発医薬品

同効薬：アカルボース、ミグリトール

7. 国際誕生年月日

1994年7月1日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
ベイスン錠 0.2	1994年	20600AMZ01120	1994年	1994年
ベイスン錠 0.3	7月1日	20600AMZ01121	8月26日	9月6日
ベイスンOD錠 0.2	2004年	21600AMZ00368	2004年	2004年
ベイスンOD錠 0.3	2月25日	21600AMZ00369	7月9日	7月14日

9. 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

(錠 0.2、OD 錠 0.2 のみ)

「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・運動療法を十分に行っても改善されない場合に限る）」に対して2009年10月16日に効能が追加された。

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

◇糖尿病の食後過血糖の改善

再審査結果公表年月日：2004年9月9日

内容：薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない。

◇耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制

再審査結果公表年月日：2017年3月30日

内容：医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第14条第2項第3号イからハまでのいずれにも該当しない。

11. 再審査期間

◇糖尿病の食後過血糖の改善

6年（1994年7月1日～2000年6月30日）

◇耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制（錠 0.2、OD 錠 0.2 のみ）

4年（2009年10月16日～2013年10月15日）

12. 投薬期間制限に関する情報

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。

### 13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
ベイスン錠 0.2	3969004F1020 (3969004F1020)	108748201	610406390
ベイスン錠 0.3	3969004F2027 (3969004F2027)	108749901	610406391
ベイスン OD 錠 0.2	3969004F3023 (3969004F3023)	116350601	620002120
ベイスン OD 錠 0.3	3969004F4020 (3969004F4020)	116562301	620002121

### 14. 保険給付上の注意

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。

(平成21年10月16日付、保医発1016第3号)

## XI：文献

### 1. 引用文献

---

- 1) 後藤由夫, 他: 臨牀と研究. 1992; 69: 1211-1236
- 2) 後藤由夫, 他: 臨牀と研究. 1992; 69: 1237-1256
- 3) 後藤由夫, 他: 医学のあゆみ. 1992; 160: 943-971
- 4) 神谷文雄, 他: 臨床成人病. 1992; 22: 573-591
- 5) 三村和郎, 他: 臨牀と研究. 1992; 69: 919-932
- 6) 梅田文夫, 他: 臨牀と研究. 1992; 69: 1309-1322
- 7) 池田義雄, 他: 新薬と臨牀. 1992; 41: 20-28
- 8) 小高裕之, 他: 日本栄養・食糧学会誌. 1992; 45: 27-31
- 9) 小高裕之, 他: 薬理と治療. 1991; 19: 4439-4450
- 10) 後藤由夫, 他: 臨床成人病. 1992; 22: 451-458
- 11) 香野修介, 他: 臨牀と研究. 1997; 74: 952-954
- 12) 平賀興吾: 基礎と臨床. 1992; 26: 283-294
- 13) 前芝良宏, 他: 薬理と治療. 1991; 19: 3639-3649
- 14) 鬼頭 剛: 薬理と治療. 1991; 19: 3623-3637
- 15) Lina B. A. R., et al.: 薬理と治療. 1991; 19: 4003-4030
- 16) Atkinson J. E., et al.: 薬理と治療. 1991; 19: 4055-4082
- 17) Til H. P., et al.: 薬理と治療. 1991; 19: 4031-4053
- 18) Atkinson J. E., et al.: 薬理と治療. 1991; 19: 4083-4104
- 19) 坂本 豊, 他: 薬理と治療. 1991; 19: 4403-4413
- 20) Atkinson J. E., et al.: 薬理と治療. 1991; 19: 4427-4438
- 21) 野々山孝, 他: 薬理と治療. 1991; 19: 4415-4425
- 22) Morseth S. L., et al.: 薬理と治療. 1991; 19: 4325-4340
- 23) Morseth S. L., et al.: 薬理と治療. 1991; 19: 4341-4363
- 24) Morseth S. L., et al.: 薬理と治療. 1991; 19: 4365-4374
- 25) Morseth S. L., et al.: 薬理と治療. 1991; 19: 4375-4396
- 26) 中井洋一, 他: 薬理と治療. 1991; 19: 4397-4401

### 2. その他の参考文献

---

該当しない

## XII：参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

---

中国、韓国、タイ、フィリピンで販売されている。(2016年10月時点)

### 2. 海外における臨床支援情報

---

該当しない

## XIII：備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

---

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### (1) 粉碎

---

個別に照会すること。

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

---

個別に照会すること。

### 2. その他の関連資料

---

特になし

