

劇薬
処方箋医薬品
(注意-医師等の処方箋
により使用すること)

インスリン グラルギン^{BS注カート} 「リリー」^①

インスリン グラルギン^{BS注ミリオペン} 「リリー」^②

Insulin Glargine BS Inj. [Lilly]

インスリン グラルギン(遺伝子組換え)
[インスリン グラルギン後続1]注射液

	①	②
承認番号	22600AMX01373	22600AMX01374
薬価収載	2015年5月	2015年5月
販売開始	2015年8月	2015年8月

貯 法: 遮光、2～8℃で保存
使用期限: 外箱等に表示

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

1. 低血糖症状を呈している患者
2. 本剤の成分又は他のインスリン グラルギン製剤に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

販売名	インスリン グラルギン BS注カート 「リリー」	インスリン グラルギン BS注ミリオペン 「リリー」
形態	カートリッジ	キット (カートリッジ製剤をあらかじめインスリンペン型 注入器に装填した使い捨て型キット)
成分・含量 (1カートリッジ 又は1キット中)	インスリン グラルギン(遺伝子組換え) [インスリン グラルギン後続1]300単位	
	濃グリセリン	51mg
添加物	m-クレゾール	8.1mg
	酸化亜鉛(亜鉛含量として)	90µg
	pH調節剤	適量
性状・剤形	無色澄明の液(注射液)	
pH	3.5～4.5	
浸透圧比 (生理食塩液に対する 比)	約0.8	

【効能・効果】

インスリン療法が適応となる糖尿病

<効能・効果に関連する使用上の注意>

糖尿病の診断が確立した患者に対してのみ適用を考慮すること。
糖尿病以外にも耐糖能異常、尿糖陽性等、糖尿病類似の症状を有する疾患(腎性糖尿、甲状腺機能異常等)があることに留意すること。

【用法・用量】

通常、成人では、初期は1日1回4～20単位を皮下注射するが、ときに他のインスリン製剤を併用することがある。注射時刻は朝食前又は就寝前のいずれでもよいが、毎日一定とする。投与量は、患者の症状及び検査所見に応じて増減する。なお、その他のインスリン製剤の投与量を含めた維持量は、通常1日4～80単位である。
ただし、必要により上記用量を超えて使用することがある。

<用法・用量に関連する使用上の注意>***

1. 適用にあたっては本剤の作用時間、1mL当たりのインスリン含有単位と患者の病状に留意し、その製剤的特徴に適合する場合に投与すること。
2. 糖尿病性昏睡、急性感染症、手術等緊急の場合は、本剤のみで処置することは適当でなく、速効型インスリン製剤を使用すること。

3. 中間型又は持続型インスリン製剤から本剤に変更する場合、以下を参考に本剤の投与を開始し、その後の患者の状態に応じて用量を増減するなど、本剤の作用特性[「薬物動態」の項参照]を考慮の上慎重に行うこと。[「重要な基本的注意」の項参照]

(1) インスリン グラルギン300単位/mL製剤から本剤に変更する場合:

通常初期用量は、前治療のインスリン グラルギン300単位/mL製剤の1日投与量と同単位よりも低用量を目安として投与を開始する。

(2) インスリン グラルギン300単位/mL製剤以外の中間型又は持続型インスリン製剤から本剤に変更する場合:

- 1) 1日1回投与の中間型又は持続型インスリン製剤から本剤に変更する場合、通常初期用量は、前治療の中間型又は持続型インスリン製剤の1日投与量と同単位を目安として投与を開始する。

- 2) 1日2回投与の中間型インスリン製剤から本剤への切り替えに関しては、使用経験がない。

(3) インスリン グラルギン300単位/mL製剤又は中間型インスリン製剤からインスリン グラルギン100単位/mL製剤への切り替え直後に低血糖があらわれることがあるので、中間型又は持続型インスリン製剤から本剤に変更する場合、併用している速効型インスリン製剤、超速効型インスリンアナログ製剤又は他の糖尿病用薬の投与量及び投与スケジュールの調整が必要となることがあるので注意すること。

4. インスリン製剤以外の他の糖尿病用薬から本剤に変更する場合又はインスリン製剤以外の他の糖尿病用薬と本剤を併用する場合:

投与にあたっては低用量から開始するなど、本剤の作用特性[「薬物動態」の項参照]を考慮の上慎重に行うこと。

5. ヒトインスリンに対する獲得抗体を有し、高用量のインスリンを必要としている患者では、他のインスリン製剤から本剤に変更することによって、本剤の需要量が急激に変化することがあるので、経過を観察しながら慎重に投与すること。

【使用上の注意】***

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1) インスリン需要の変動が激しい患者
 - 1) 手術、外傷、感染症等の患者
 - 2) 妊婦[「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照]
- (2) 次に掲げる低血糖を起こしやすい患者又は状態
 - 1) 重篤な肝又は腎機能障害
 - 2) 脳下垂体機能不全又は副腎機能不全
 - 3) 下痢、嘔吐等の胃腸障害
 - 4) 飢餓状態、不規則な食事摂取
 - 5) 激しい筋肉運動
 - 6) 過度のアルコール摂取者
 - 7) 高齢者[「高齢者への投与」の項参照]
 - 8) 血糖降下作用を増強する薬剤との併用[「相互作用」の項参照]
- (3) 低血糖を起こすと事故につながるおそれがある患者(高所作業、自動車の運転等の作業に従事している患者等)

(4) 自律神経障害の患者〔アドレナリンの欠乏により低血糖の自覚症状が明確でないことがある。〕

2. 重要な基本的注意

(1) インスリン製剤の使用上最も重要なことは、適応の決定と患者教育である。日常の糖尿病治療のためにインスリンを使用する場合、その注射法及び低血糖に対して患者自らも対処できるように十分指導すること。また、皮下からの吸収及び作用の発現時間は、血流、体温、運動量等により異なるため、適切な注射法についても患者教育を十分行うこと。さらに、カートの使用にあたっては、必ず専用のインスリンペン型注入器の取扱説明書を読むよう指導し、ミリオペンの使用にあたっては、必ず添付の取扱説明書を読むよう指導すること。また、すべての器具の安全な廃棄方法についても十分指導すること。

(2) 2型糖尿病においては、急を要する場合以外は、あらかじめ糖尿病治療の基本である食事療法、運動療法を十分行っただうえで適用を考慮すること。

(3) 低血糖を起こすことがあるので、注意すること。特に、食事を摂取しなかったり、予定外の激しい運動を行った場合、低血糖を引き起こしやすい。低血糖が無処置の状態で続くとき低血糖昏睡等を起こし、重篤な転帰（中枢神経系の不可逆的障害、死亡等）をとるおそれがある。また、低血糖に関する注意について、患者及びその家族に十分徹底させること。〔副作用〕の項参照]

(4) 本剤の作用は皮下に注射することにより、明らかなピークを示さず、ほぼ24時間持続する特徴を有することから、特に他のインスリン製剤からの切り替え時など、低血糖発現状態の変化に十分注意すること。〔薬物動態〕及び〔薬効薬理〕の項参照]

(5) インスリン グラルギン300単位/mL製剤から本剤への切り替え時には、前治療のインスリン グラルギン300単位/mL製剤の1日投与量よりも低用量での切り替えを考慮するとともに、切り替え時及びその後しばらくの間は血糖モニタリングを慎重に行うこと。〔インスリン グラルギン100単位/mL製剤とインスリン グラルギン300単位/mL製剤では薬物動態が異なる。インスリン グラルギン300単位/mL製剤からインスリン グラルギン100単位/mL製剤への切り替え時に低血糖の発現が増加した。〕

(6) インスリンの用量が不足した場合、高血糖を起こすことがあるので、注意すること。
 高血糖が無処置の状態で続くとき悪心、嘔吐、眠気、潮紅、口渇、頻尿、脱水、食欲減退、呼気のアセトン臭、ケトアシドーシス、昏睡等を起こし、重篤な転帰をとるおそれがあるため、適切な処置を行うこと。

(7) 急激な血糖コントロールに伴い、糖尿病網膜症の顕在化又は増悪、眼の屈折異常、治療後神経障害（主として有痛性）があらわれることがあるので注意すること。

(8) 本剤は無色澄明な液剤であるため、速効型インスリン製剤又は超速効型インスリンアナログ製剤と間違えないよう患者に十分な指導を行うこと。

3. 相互作用

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 ビグアナイド系薬剤 スルホニルウレア系薬剤 速効型インスリン分泌促進剤 α-グルコシダーゼ阻害剤 チアゾリジン系薬剤 DPP-4阻害薬 GLP-1受容体作動薬 SGLT2阻害剤等	血糖降下作用の増強による低血糖症状があらわれることがある。併用する場合は血糖値その他患者の状態を十分観察しながら投与すること。〔副作用〕の項参照]	血糖降下作用が増強される。
モノアミン酸化酵素(MAO)阻害剤		インスリンの分泌を促進し、糖新生を阻害する。
三環系抗うつ剤 ノルトリプチリン塩酸塩等		機序は不明であるが、インスリン感受性を増強するなどの報告がある。
サリチル酸誘導体 アスピリン エテンザミド		β細胞の糖に対する感受性の亢進、インスリン分泌促進により血糖降下作用を示す。また末梢で弱いインスリン様作用を有する。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
抗腫瘍剤 シクロホスファミド水和物	血糖降下作用の増強による低血糖症状があらわれることがある。	インスリンが結合する抗体の生成を抑制し、その結合部位からインスリンを遊離させる可能性がある。
クマリン系薬剤 ワルファリンカリウム	併用する場合は血糖値その他患者の状態を十分観察しながら投与すること。〔副作用〕の項参照]	機序不明
クロラムフェニコール サルファ剤	併用する場合は血糖値その他患者の状態を十分観察しながら投与すること。〔副作用〕の項参照]	機序不明 膵臓でのインスリン分泌を増加させることにより、低血糖を起こすと考えられている。腎機能低下、空腹状態の遷延、栄養不良、過量投与が危険因子となる。
シベンゾリンコハク酸塩 ジソピラミド ピルメノール塩酸塩水和物		動物実験においてインスリンの分泌を促進するとの報告があり、血糖降下作用が増強される可能性がある。
フィブラート系薬剤		インスリン感受性増強等の作用により、本剤の作用を増強する。
レセルピン		低血糖に対する交感神経系の症状(振戦、動悸等)をマスクし、低血糖を遷延させる可能性がある。
チアジド系利尿剤 トリクロルメチアジド ループ利尿剤 フロセミド	血糖降下作用の減弱による高血糖症状があらわれることがある。〔重要な基本的注意〕の項参照]	カリウム喪失が関与すると考えられている。カリウム欠乏時には、血糖上昇反応に対するβ細胞のインスリン分泌能が低下する可能性がある。
副腎皮質ステロイド プレドニゾン トリアムシノロン	併用する場合は血糖値その他患者の状態を十分観察しながら投与すること。	末梢組織でインスリンの作用に拮抗し、また糖新生を促進する。
ACTH テトラコサクチド酢酸塩 アドレナリン		糖質コルチコイドの産生を促し、血糖上昇作用を示す。 肝での糖新生の促進、末梢での糖利用抑制、インスリン分泌抑制により血糖を上昇させる。
グルカゴン		肝グリコーゲン分解促進、糖新生の亢進により血糖を上昇させる。
甲状腺ホルモン レボチロキシナトリウム水和物 乾燥甲状腺		肝での糖新生を亢進させる可能性がある。
成長ホルモン ソマトロピン		抗インスリン作用を有する。
卵胞ホルモン エチニルエストラジオール 結合型エストロゲン		末梢組織でインスリンの作用に拮抗する。
経口避妊薬		末梢組織でインスリンの作用に拮抗する。
ニコチン酸		末梢組織でのインスリン感受性を低下させるため耐糖能障害を起こす。
濃グリセリン		代謝されて糖になるため、血糖値が上昇する。
イソニアジド		炭水化物代謝を阻害し、血糖値を上昇させる。
ダナゾール フェニトイン		抗インスリン作用を有する。 インスリン分泌抑制作用を有する。
ブセレリン酢酸塩		機序不明 耐糖能を悪化させることがある。
フェノチアジン誘導体		機序は不明であるが、動物実験(ラット)において、インスリン分泌が減少したとの報告がある。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
蛋白同化ステロイド メスタノロン	血糖降下作用の増強による低血糖	機序不明
ソマトスタチンアナログ製剤 オクトレオチド酢酸塩 ランレオチド酢酸塩	糖症状〔副作用〕の項参照〕、又は減弱による高血糖	インスリン、成長ホルモン及びグルカゴン又はうちいずれかの分泌に影響する。
ペンタミジンイセチオン酸塩	糖症状〔重要な基本的注意〕の項参照〕があらわれることがある。	膵臓のβ細胞に作用し、初期に低血糖、それに引き続いて高血糖を起こすことがある。
β-遮断剤 プロプラノロール塩酸塩 アテノロール ビンドロール セリプロロール塩酸塩等	併用する場合は血糖値その他患者の状態を十分観察しながら投与すること。	アドレナリンによる低血糖からの回復反応を抑制する。また低血糖に対する交感神経系の症状(振戦、動悸等)をマスクし、低血糖を遷延させる可能性がある。
炭酸リチウム		機序不明 インスリン分泌が減少したとの報告、逆に低血糖が発現したとの報告がある。
クロニジン		機序不明 血糖値が低下したとの報告、逆に血糖値を上昇させたとの報告がある。また、低血糖に対する交感神経系の症状(振戦、動悸等)をマスクし、低血糖を遷延させる可能性がある。

4. 副作用

承認時までに実施された1型糖尿病患者を対象とした第Ⅲ相国際共同試験(52週間投与)の安全性評価対象症例268例(日本人49例)及び2型糖尿病患者を対象とした外国第Ⅲ相試験(24週間投与)の安全性評価対象症例376例の計644例中43例(6.7%)に副作用(臨床検査値異常を含む)が報告された。主なものは、低血糖(12例:1.9%)、体重増加(11例:1.7%)、注射部位疼痛(4例:0.6%)、そう痒症(4例:0.6%)であった。

(1) 重大な副作用

- 低血糖(1.9%) : 低血糖(脱力感、倦怠感、高度の空腹感、冷汗、顔面蒼白、動悸、振戦、頭痛、めまい、嘔気、知覚異常、不安、興奮、神経過敏、集中力低下、精神障害、痙攣、意識障害(意識混濁、昏睡等)があらわれることがある。
 なお、徐々に進行する低血糖では、精神障害、意識障害等が主である場合があるので注意すること。また、長期にわたる糖尿病、糖尿病性神経障害、β-遮断剤投与あるいは強化インスリン療法が行われている場合では、低血糖の初期の自覚症状(冷汗、振戦等)が通常と異なる場合や、自覚症状があらわれなまま、低血糖あるいは低血糖性昏睡に陥ることがある。
 低血糖症状が認められた場合には通常はショ糖を経口摂取し、α-グルコシダーゼ阻害剤(アカルボース、ボグリボース等)との併用により低血糖症状が認められた場合にはブドウ糖を経口摂取すること。
 経口摂取が不可能な場合はブドウ糖を静脈内に投与するか、グルカゴンを筋肉内又は静脈内投与すること。低血糖は臨床的にいったん回復したと思われる場合にも後で再発することがある。また、本剤の作用は持続的であるため、経過観察を継続して行うことが必要である。
- ショック、アナフィラキシー(頻度不明)、血管神経性浮腫(頻度不明) : ショック、アナフィラキシー(呼吸困難、血圧低下、頻脈、発汗、全身の発疹等)、血管神経性浮腫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し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

副作用分類	頻度不明	0.1～5%未満
過敏症	蕁麻疹	そう痒症、発疹
神経系		味覚異常
肝臓	肝機能異常〔AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇等〕	
眼	糖尿病網膜症の顕在化又は増悪	
注射部位	注射部位反応(浮腫、発赤、蕁麻疹、腫脹、炎症、リポハイポトロフィー(皮下脂肪の萎縮・肥厚等))	注射部位反応(疼痛、そう痒感、硬結、結節)
その他	ナトリウム貯留	体重増加、浮腫

5. 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ことが多く、低血糖が起りやすいので、用量に留意し、定期的に検査を行うなど慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。妊娠した場合、あるいは妊娠が予測される場合には医師に知らせるよう指導すること。妊娠中、周産期、授乳期等にはインスリンの需要量が増加しやすいので、用量に留意し、定期的に検査を行い投与量を調整すること。通常インスリン需要量は、妊娠初期は減少し、中期及び後期は増加する。本剤のヒト母乳移行は不明である。

7. 小児等への投与

成長及び活動性に依りてインスリンの需要量が増加するので、定期的に検査を行うなどして投与すること。

8. 過量投与

(1) 徴候・症状

低血糖は、食事、エネルギー消費又はその両方との関連で、本剤が相対的に過剰となって起こることがある。また、低血糖は臨床的にいったん回復したと思われる場合にも後で再発することがあるので、炭水化物の摂取や経過観察を継続して行うことが必要な場合がある。〔副作用〕の項参照]

(2) 処置

低血糖の起こる時間はインスリンの種類、量等により異なるため、低血糖が発現しやすい時間帯に特に経過を観察し、以下を参考に、速やかに適切な処置を行うこと。〔副作用〕の項参照]

- ショ糖を経口摂取する。ただし、α-グルコシダーゼ阻害剤を併用中の場合は、必ずブドウ糖を経口摂取すること。
- ブドウ糖を静脈内投与する。
- グルカゴンを筋肉内又は静脈内投与する。

9. 適用上の注意

(1) 投与時

<カート>

- 本剤は無色澄明な液剤である。液中に塊が見られた場合は使用しないこと。
- 使用開始前にインスリン製剤のラベルを確認し、本剤と他のインスリン製剤とを取り間違えないようにすること。
- 本剤は必ず弊社専用のインスリンペン型注入器を用いて使用すること。他の注入器を用いて使用してはならない。また本剤のカートリッジにインスリン製剤を補充したり、他のインスリン製剤と混合してはならない。
- 1本を複数の患者に使用しないこと。

<ミリオベン>

- 本剤は無色澄明な液剤である。液中に塊が見られた場合は使用しないこと。
- 使用開始前にインスリン製剤のラベルを確認し、本剤と他のインスリン製剤とを取り間違えないようにすること。
- 本剤のカートリッジにインスリン製剤を補充したり、他のインスリン製剤と混合してはならない。
- 本剤はJIS T 3226-2に準拠したA型専用注射針を用いて使用すること。〔本剤はA型専用注射針との適合性の確認を BD マイクロファイナプラス及びナノパスニュードルで行っている。〕
- 本剤とA型専用注射針との装着時に液漏れ等の不具合が認められた場合には、新しい注射針に取り替える等の処置方法を患者に十分指導すること。
- 1本を複数の患者に使用しないこと。

(2) 投与部位

皮下注射は、腹部、大腿部、上腕部、臀部等に行うが、同一部位内で投与する場合は前回の注射場所より2～3cm離して注射すること。

(3) 投与経路

静脈内に投与しないこと。
 皮下注射したとき、まれに注射針が血管内に入り、注射後直ちに低血糖があらわれることがあるので注意すること。

(4) 保存時

<カート>

- 凍結を避け、2～8℃で遮光保存すること。
- 本剤をインスリンペン型注入器に装着したまま冷蔵庫に保存しないこと。
- 使用開始後は、30℃以下の室温で、高温および直射日光を避けて保存すること。

- d 使用開始後28日以内に使用すること。
 <ミリオベン>
 a 凍結を避け、2～8℃で遮光保存すること。
 b 使用開始後は、30℃以下の室温で、高温および直射日光を避けて保存すること。冷蔵庫に保存しないこと。
 c 使用開始後28日以内に使用すること。

10. その他の注意

- (1) インスリン又は経口血糖降下剤の投与中にアンジオテンシン変換酵素阻害剤を投与することにより、低血糖が起こりやすいとの報告がある¹⁾。
 (2) ビオグリタゾンと併用した場合、浮腫が多く報告されている。併用する場合には、浮腫及び心不全の徴候を十分観察しながら投与すること。

【薬物動態】*

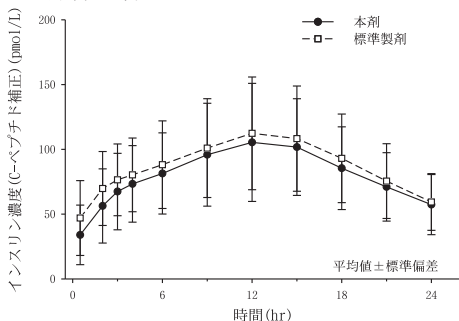
外国人での成績

24時間正常血糖クランプ法実施下で、健康成人に本剤又は標準製剤0.5単位/kg⁽²⁾を単回皮下投与したときの血清中インスリン濃度(C-ペプチド補正)及び血糖降下作用(最大グルコース注入率及び累積グルコース注入量)の結果を以下に示す²⁾。

注)本剤の承認された用法・用量は「用法・用量」の項参照

1. 血清中インスリン濃度(C-ペプチド補正)

薬物動態パラメータ(AUC₀₋₂₄及びC_{max})について、本剤の標準製剤に対する最小二乗幾何平均値の比の90%信頼区間は80～125%の範囲内であり、両剤の同等性が確認された。



<本剤又は標準製剤0.5単位/kgの単回皮下投与後の血清中インスリン濃度(C-ペプチド補正)推移(4期クロスオーバー法)>

本剤又は標準製剤0.5単位/kgの単回皮下投与後の薬物動態パラメータ(4期クロスオーバー法)

	N ⁽¹⁾ (n)	AUC ₀₋₂₄ (pmol·h/L)	AUC _{0-∞} (pmol·h/L)	C _{max} (pmol/L)	T _{max} ⁽²⁾ (hr)	T _{1/2} (hr)
本剤	78 (156)	1820 ⁽³⁾ (40)	2830 ⁽⁴⁾ (39)	113 (39)	12.0 (2.0-24.0)	9.83 ⁽⁴⁾ (66)
標準製剤	78 (156)	1980 ⁽⁵⁾ (36)	2930 ⁽⁶⁾ (41)	119 (34)	12.0 (0.5-21.0)	9.75 ⁽⁶⁾ (61)

幾何平均値(CV%)

注1)N=被験者数、n=パラメータ数

注2)中央値(範囲)

注3)n=154

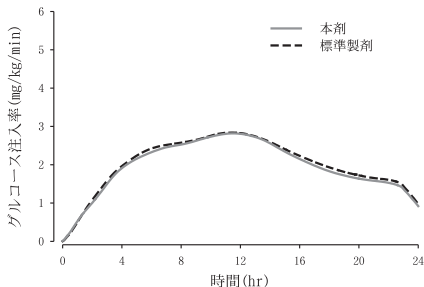
注4)n=149

注5)n=155

注6)n=152

2. 血糖降下作用

最大グルコース注入率及び累積グルコース注入量について、本剤の標準製剤に対する最小二乗幾何平均値の比の95%信頼区間は80～125%の範囲内であり、両剤の同等性が確認された。



<本剤又は標準製剤0.5単位/kgの単回皮下投与後のグルコース注入率の推移(4期クロスオーバー法)>

本剤又は標準製剤0.5単位/kgの単回皮下投与後の最大グルコース注入率及び累積グルコース注入量(4期クロスオーバー法)

	N ⁽¹⁾ (n)	最大グルコース注入率 (mg/kg/min)	累積グルコース注入量 (mg/kg)
本剤	78 (156)	2.87 (46)	2590 (45)
標準製剤	78 (156)	2.89 (41)	2720 (39)

幾何平均値(CV%)

注1)N=被験者数、n=パラメータ数

【臨床成績】*

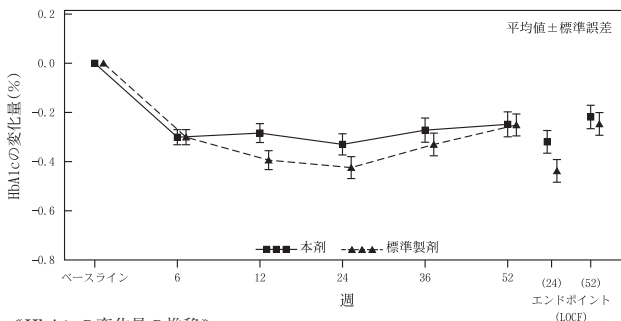
1型糖尿病試験成績(第Ⅲ相国際共同試験)³⁾

成人1型糖尿病患者を対象としたインスリンリスプロ1日3回食前皮下投与併用時における本剤と標準製剤1日1回皮下投与を比較する、無作為化、非盲検、第Ⅲ相国際共同試験[本剤群269例(日本人49例)、標準製剤群267例(日本人51例)]を実施した。主要評価項目である24週時におけるHbA1cのベースラインからの変化量(最小二乗平均値)の群間差(本剤群-標準製剤群)は0.108%(95%信頼区間:-0.002～0.219%)⁽³⁾であり、本剤は標準製剤に対して非劣性であることが示された(非劣性マージン:0.4%)。

さらに、52週時におけるHbA1cのベースラインからの変化量(最小二乗平均値)の群間差(本剤群-標準製剤群)は0.020%(95%信頼区間:-0.099～0.140%)⁽³⁾であり、24週時と同様の結果が得られた。

また、本剤群と標準製剤群間で抗体価は類似しており、抗体価とHbA1c、インスリン投与量、低血糖の発生率及び頻度との間には関連がなかった。

注)実施国、投与群、基礎インスリン投与時間(日中、夕方/就寝前)、ベースライン値を説明変数とした共分散分析モデル



<HbA1cの変化量の推移>

【薬効薬理】*

インスリン グラルギン(遺伝子組換え)[インスリン グラルギン後続1]は、中性のpH領域で低い溶解性を示すように設計されたヒトインスリンアナログである。インスリン グラルギン(遺伝子組換え)[インスリン グラルギン後続1]の注射剤である本剤は酸性(約pH4)の無色澄明な溶液であるが、皮下に投与すると中和され微細な沈殿物を形成する。この沈殿物からインスリン グラルギン(遺伝子組換え)[インスリン グラルギン後続1]が緩徐に放出されることから、その血中濃度推移はなめらかで明らかなピークを示さず予測可能であり、作用がほぼ24時間持続する。

In vitroにおけるインスリン受容体及びIGF-1受容体に対する結合親和性は、インスリン グラルギン(遺伝子組換え)と同程度であった⁴⁾。インスリン グラルギン(遺伝子組換え)[インスリン グラルギン後続1]は、インスリン受容体に対してインスリンと同程度の結合親和性を示し、インスリン受容体を介してインスリンと同様の作用を示すと考えられる⁴⁾。インスリン及びインスリン グラルギン(遺伝子組換え)[インスリン グラルギン後続1]を含むそのアナログの主要な活性は、グルコース代謝の調節にある。インスリン及びそのアナログは、末梢におけるグルコースの取り込み、特に骨格筋及び脂肪による取り込みを促進し、また肝におけるグルコース産生を阻害することによって血糖値を降下させる。更に、蛋白分解を阻害し、蛋白合成を促進するとともに、脂肪細胞における脂肪分解を阻害する。

【有効成分に関する理化学的知見】

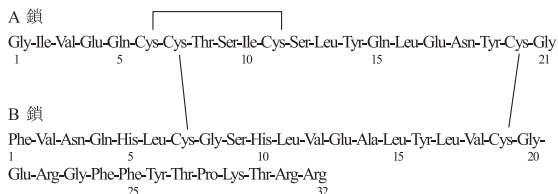
一般名: インスリン グラルギン(遺伝子組換え)[インスリン グラルギン後続1](JAN)

Insulin Glargine (Genetical Recombination) [Insulin Glargine Biosimilar 1]

分子式: C₂₆₇H₄₀₄N₇₂O₇₈S₆

分子量: 6062.89

構造式:



性状: 白色の粉末又は塊である。水、アセトニトリル及びエタノール(99.5)にはほとんど溶けない。吸湿性である。

等電点: 約6.8

【承認条件】

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

【包装】

注射剤 3mL(100単位/mL):2カートリッジ

注射剤 3mL(100単位/mL):2キット

【主要文献及び文献請求先】

- 1) Herings, R. M. C. et al.:Lancet, 345, 1195 (1995)
- 2) 社内資料:外国人健康成人を対象とした生物学的同等性試験
- 3) 社内資料:1型糖尿病患者における第Ⅲ相国際共同試験
- 4) 社内資料:*In vitro*受容体結合親和性

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

日本イーライリリー株式会社
〒651-0086 神戸市中央区磯上通7丁目1番5号

Lilly Answers リリーアンサーズ

日本イーライリリー医薬情報問合せ窓口

0120-360-605(医療関係者向け)

受付時間:月～金 8:45～17:30

www.lillyanswers.jp

®:登録商標

製造販売元

日本イーライリリー株式会社

神戸市中央区磯上通7丁目1番5号

販売提携

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社

東京都品川区大崎2丁目1番1号

PV0924JJAP