

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 2008 に準拠して作成

食後過血糖改善剤

処方せん医薬品

アカルボース錠 50mg「YD」
アカルボース錠 100mg「YD」

ACARBOSE TABLETS「YD」

アカルボース錠

剤形	錠剤（素錠）
製剤の規制区分	処方せん医薬品（注意—医師等の処方せんにより使用すること）
規格・含量	アカルボース錠 50mg「YD」：1錠中アカルボース 50mg を含有 アカルボース錠 100mg「YD」：1錠中アカルボース 100mg を含有
一般名	和名：アカルボース（JAN） 洋名：Acarbose（JAN）
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：2009年1月14日 薬価基準収載年月日：2009年5月15日 発売年月日：2009年5月15日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：株式会社陽進堂 販売元：第一三共エスファ株式会社 販売提携：第一三共株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	第一三共エスファ株式会社 お客様相談室 TEL：0120-100-601 医療関係者向けホームページ： http://www.daiichisankyo-ep.co.jp/

本 IF は 2014 年 1 月改訂（第 6 版）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、医薬品医療機器情報提供ホームページ <http://www.info.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年が経過した現在、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新たなIF記載要領が策定された。

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2008」（以下、「IF記載要領2008」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2008」は、平成21年4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2008」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2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、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、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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、今後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。

(2008年9月)

目 次

I. 概要に関する項目	1	9. 製剤中の有効成分の確認試験法	9
1. 開発の経緯	1	10. 製剤中の有効成分の定量法	9
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	11. 力 価	9
II. 名称に関する項目	2	12. 混入する可能性のある夾雑物	9
1. 販売名	2	13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	9
(1) 和 名	2	14. その他	9
(2) 洋 名	2	V. 治療に関する項目	10
(3) 名称の由来	2	1. 効能又は効果	10
2. 一般名	2	2. 用法及び用量	10
(1) 和 名 (命名法)	2	3. 臨床成績	10
(2) 洋 名 (命名法)	2	(1) 臨床データパッケージ	10
(3) システム	2	(2) 臨床効果	10
3. 構造式又は示性式	2	(3) 臨床薬理試験：忍容性試験	10
4. 分子式及び分子量	2	(4) 探索的試験：用量反応探索試験	10
5. 化学名 (命名法)	2	(5) 検証的試験	10
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	1) 無作為化並行用量反応試験	10
7. CAS登録番号	2	2) 比較試験	10
8. 患者・病態別試験	10	3) 安全性試験	10
9. 治療の使用	10	4) 患者・病態別試験	10
10. 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)	10	(6) 治療の使用	10
11. 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	10	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)	10
12. 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	10	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	10
III. 有効成分に関する項目	3	VI. 薬効薬理に関する項目	11
1. 物理化学的性質	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	11
(1) 外観・性状	3	2. 薬理作用	11
(2) 溶解性	3	(1) 作用部位・作用機序	11
(3) 吸湿性	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	11
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	3	(3) 作用発現時間・持続時間	12
(5) 酸塩基解離定数	3	VII. 薬物動態に関する項目	13
(6) 分配係数	3	1. 血中濃度の推移・測定法	13
(7) その他の主な示性値	3	(1) 治療上有効な血中濃度	13
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(2) 最高血中濃度到達時間	13
3. 有効成分の確認試験法	3	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	13
4. 有効成分の定量法	3	(4) 中毒域	13
5. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	(5) 食事・併用薬の影響	13
6. 製剤の組成	4	(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	13
(1) 有効成分(活性成分)の含量	4	2. 薬物速度論的パラメータ	13
(2) 添加物	4	(1) コンパートメントモデル	13
(3) その他	4	(2) 吸収速度定数	13
7. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	(3) バイオアベイラビリティ	13
8. 製剤の各種条件下における安定性	5	(4) 消失速度定数	13
9. 調製法及び溶解後の安定性	5	(5) クリアランス	13
10. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5	(6) 分布容積	13
11. 溶出性	5		
12. 生物学的試験法	9		

(7) 血漿蛋白結合率	13	13. 過量投与	19
3. 吸 収	13	14. 適用上の注意	20
4. 分 布	13	15. その他の注意	20
(1) 血液－脳関門通過性	13	16. その他	20
(2) 血液－胎盤関門通過性	13		
(3) 乳汁への移行性	14	IX. 非臨床試験に関する項目	21
(4) 髄液への移行性	14	1. 薬理試験	21
(5) その他の組織への移行性	14	(1) 薬効薬理試験	21
5. 代 謝	14	(2) 副次的薬理試験	21
(1) 代謝部位及び代謝経路	14	(3) 安全性薬理試験	21
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等） の分子種	14	(4) その他の薬理試験	21
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	14	2. 毒性試験	21
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	14	(1) 単回投与毒性試験	21
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	14	(2) 反復投与毒性試験	21
6. 排 泄	14	(3) 生殖発生毒性試験	21
(1) 排泄部位及び経路	14	(4) その他の特殊毒性	21
(2) 排泄率	14		
(3) 排泄速度	14	X. 管理的事項に関する項目	22
7. 透析等による除去率	14	1. 規制区分	22
		2. 有効期間又は使用期限	22
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	15	3. 貯法・保存条件	22
1. 警告内容とその理由	15	4. 薬剤取扱い上の注意点	22
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	15	5. 承認条件等	22
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意 とその理由	15	6. 包 装	22
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意 とその理由	15	7. 容器の材質	22
5. 慎重投与内容とその理由	15	8. 同一成分・同効薬	22
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16	9. 国際誕生年月日	23
7. 相互作用	16	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	23
(1) 併用禁忌とその理由	16	11. 薬価基準収載年月日	23
(2) 併用注意とその理由	17	12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の 年月日及びその内容	23
8. 副作用	18	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	23
(1) 副作用の概要	18	14. 再審査期間	23
(2) 重大な副作用と初期症状	18	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	23
(3) その他の副作用	18	16. 各種コード	23
(4) 項目別副作用発現頻度及び 臨床検査値異常一覧	19	17. 保険給付上の注意	23
(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	19		
(6) 薬物アレルギーに対する注意 及び試験法	19	XI. 文 献	24
9. 高齢者への投与	19	1. 引用文献	24
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19	2. その他の参考文献	24
11. 小児等への投与	19		
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19	XII. 参考資料	25
		1. 主な外国での発売状況	25
		2. 海外における臨床支援情報	25
		XIII. 備 考	26
		その他の関連資料	26

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アカルボースは、小腸粘膜微絨毛膜に存在するグルコアミラーゼなどの酵素を阻害し、また、膵液・唾液の α -アミラーゼを阻害して、食後の急激な血糖値上昇を抑制する食後過血糖改善剤である。

アカルボース錠 50mg「YD」及びアカルボース錠 100mg「YD」は株式会社陽進堂が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき規格及び試験方法を設定して、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2009 年 1 月に承認を取得し、2009 年 5 月より販売を開始した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) アカルボースは、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（ α -グルコシダーゼ）を阻害することで、糖質の消化・吸収を遅延させ、食後の過血糖を改善する。
- (2) 重大な副作用として、低血糖、腸閉塞、肝機能障害、黄疸が報告されている。また、類薬（ボグリボース）で重篤な肝硬変例での意識障害を伴う高アンモニア血症が報告されている。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1)和 名

アカルボース錠 50mg 「YD」

アカルボース錠 100mg 「YD」

(2)洋 名

ACARBOSE TABLETS 50mg 「YD」

ACARBOSE TABLETS 100mg 「YD」

(3)名称の由来

成分名

2. 一般名

(1)和 名 (命名法)

アカルボース (JAN)

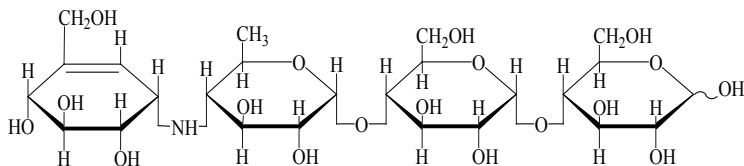
(2)洋 名 (命名法)

Acarbose (JAN)

(3)ステム

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₂₅H₄₃NO₁₈

分子量 : 645.60

5. 化学名 (命名法)

O-4,6-Dideoxy-4-[[*(1S,4R,5S,6S)*-4,5,6-trihydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]amino]- α -D-glucopyranosyl-(1→4)-*O*- α -D-glucopyranosyl-(1→4)-D-glucopyranose (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

7. CAS 登録番号

56180-94-0

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～微黄白色の粉末である。

(2) 溶解性

水に極めて溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、ジクロロメタンにほとんど溶けない。

溶解度 (37°C) ¹⁾

pH1.2	10mg/mL 以上
pH4.0	10mg/mL 以上
pH6.8	10mg/mL 以上
水	10mg/mL 以上

(3) 吸湿性

吸湿性である。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数 ¹⁾

pKa : 5.1 (滴定法)

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

旋光度 : $[\alpha]_D^{20}$: +171~+181° (脱水物に換算したもの 0.25g、水、25mL、100mm)

1g を新たに煮沸して冷却した水 20mL に溶かした液の pH は 5.5~7.5 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性 ¹⁾

水	37°C、4 時間は安定である。
液性 (pH)	pH1.2、pH4.0 及び pH6.8 において、37°C、4 時間は安定である。
光	水溶液中で、室内散光 (約 1000Lux) 下、4 時間は安定である。

3. 有効成分の確認試験法

(1) フェーリング試液による沈殿反応

(2) p-ベンゾキノン試液による呈色反応

(3) 赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)




4. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

販売名	有効成分	剤形	色	外形			識別コード (PTP)
				直径 (mm)	厚さ (mm)	重さ (mg)	
アカルボース錠 50mg「YD」	1錠中 アカルボース 50mg 含有	錠剤	白色～ 淡黄色				YD 556
				約 6	約 2.7	100	
アカルボース錠 100mg「YD」	1錠中 アカルボース 100mg 含有	錠剤 (割線入)	白色～ 淡黄色				YD 557
				約 8	約 3.1	200	

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

アカルボース錠 50mg「YD」 : YD556 (錠剤、PTP シート表面)

アカルボース錠 100mg「YD」 : YD557 (錠剤、PTP シート表面)

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分 (活性成分) の含量

アカルボース錠 50mg「YD」 : 1錠中にアカルボース 50mg を含有

アカルボース錠 100mg「YD」 : 1錠中にアカルボース 100mg を含有

(2) 添加物

トウモロコシデンプン、セルロース、無水ケイ酸、ステアリン酸 Mg

(3) その他

該当しない

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²⁾

(1) 加速条件下での安定性試験

アカルボース錠 50mg「YD」及びアカルボース錠 100mg「YD」の最終包装製品を加速条件下（40±1℃、75±5%RH）で1、3及び6ヵ月間保存した検体について、製剤の規格及び試験方法により試験した結果、いずれも規格に適合した。これより、アカルボース錠 50mg「YD」及びアカルボース錠 100mg「YD」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

PTP 包装

試験項目〔規格値〕		40±1℃、75±5%RH			
		開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状	錠 50mg〔白色～淡黄色の錠剤〕	適	適	適	適
	錠 100mg〔白色～淡黄色の割線入り錠剤〕	適	適	適	適
確認試験		適	適	適	適
純度試験		適	適	適	適
製剤均一性試験		適	適	適	適
溶出試験	錠 50mg〔水、15分、85%以上〕	適	適	適	適
	錠 100mg〔水、30分、85%以上〕	適	適	適	適
定量 (%)〔95.0～105.0%〕	錠 50mg	98.2～100.5	102.1～104.1	99.1～101.9	98.4～100.4
	錠 100mg	100.2～102.2	101.5～102.4	98.7～100.6	97.8～99.2

(2) 長期保存試験

アカルボース錠 50mg「YD」及びアカルボース錠 100mg「YD」のそれぞれの最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。

PTP 包装

試験項目〔規格値〕		25±2℃、60±5%RH			
		開始時	1年後	2年後	3年後
性状	錠 50mg〔白色～淡黄色の錠剤〕	適	適	適	適
	錠 100mg〔白色～淡黄色の割線入り錠剤〕	適	適	適	適
確認試験		適	／	／	適
純度試験		適	適	適	適
製剤均一性試験		適	／	／	適
溶出試験	錠 50mg〔水、15分、85%以上〕	適	適	適	適
	錠 100mg〔水、30分、85%以上〕	適	適	適	適
定量 (%)〔95.0～105.0%〕	錠 50mg	100.6	102.2	102.4	100.0
	錠 100mg	101.0	100.4	102.7	100.2

(3) 無包装状態の安定性

アカルボース錠 50mg「YD」及びアカルボース錠 100mg「YD」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〔性状、硬度、溶出試験、定量、純度〕を行った。

試験条件		結果	
		アカルボース錠 50mg「YD」	アカルボース錠 100mg「YD」
通常条件	25℃、60%RH、3ヵ月、遮光	性状やや着色、純度不適	性状やや着色、純度不適
温度、湿度	40℃、75%RH、3ヵ月、遮光	性状着色、純度不適	性状着色、純度不適
光	総照射量 120 万 Lux・hr（開放）	性状やや着色	性状やや着色

IV. 製剤に関する項目

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³⁾

(1) 公的溶出規格への適合性

アカルボース錠 50mg「YD」及びアカルボース錠 100mg「YD」は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたアカルボース錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

溶出規格				
表示量	試験液	回転数	規定時間	溶出率
50mg	水	75rpm	15分	85%以上
100mg			30分	85%以上

(2) 溶出挙動における類似性

1) アカルボース錠 50mg「YD」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 9 年 12 月 22 日付 医薬審第 487 号、平成 13 年 5 月 31 日付 医薬審第 786 号及び平成 18 年 11 月 24 日付 薬食審査発第 1124004 号）」

試験方法：日局一般試験法「溶出試験第 2 法（パドル法）」による。

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH4.0 薄めた McIlvaine 緩衝液

pH6.8 日本薬局方溶出試験第 2 液

水 日本薬局方精製水

回転数：50rpm

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って類似性を判定した。

【pH1.2、50rpm】：

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

【pH4.0、50rpm】、【pH6.8、50rpm】、【水、50rpm】：

標準製剤が 15 分～30 分に平均 85%以上溶出する場合

標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。

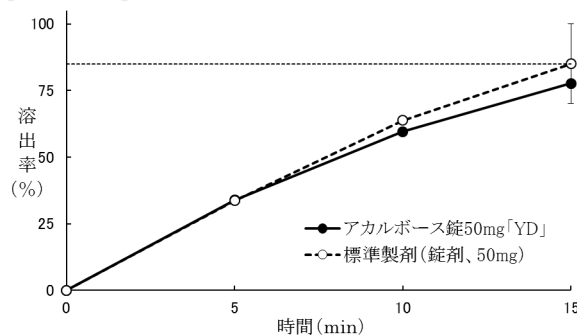
試験結果：すべての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

溶出挙動における類似性（アカルボース錠 50mg「YD」及び標準製剤の平均溶出率の比較）

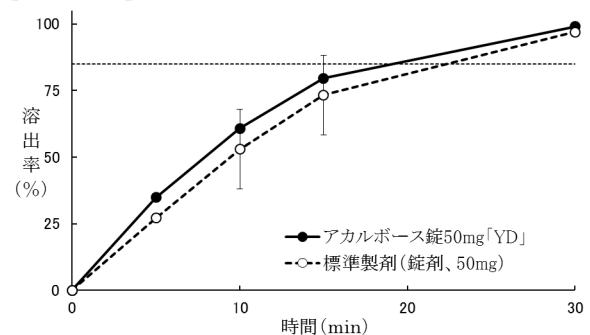
試験条件		溶出時間 (分)	平均溶出率(%)			判定	判定基準 (アカルボース錠 50mg 「YD」の溶出条件)
			アカルボース錠 50mg「YD」	標準製剤 (錠剤、50mg)	差 (絶対値)		
50rpm	pH1.2	15	77.7	85.1	7.4	適	≥85%又は±15%
	pH4.0	10	60.8	53.0	7.8	適	
		15	79.6	73.3	6.3		
	pH6.8	10	55.5	55.5	0.0	適	±15%又はf2 関数≥42
		15	73.9	76.5	2.6		
	水	10	53.1	56.2	3.1	適	
15		71.4	76.4	5.0			

(溶出曲線)

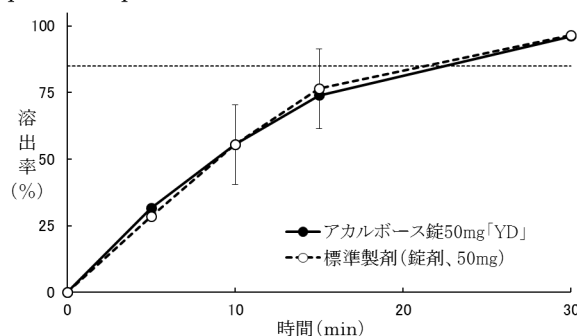
pH1.2/50rpm



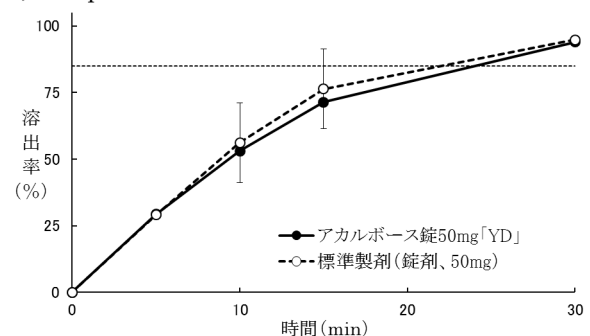
pH4.0/50rpm



pH6.8/50rpm



水/50rpm



2) アカルボース錠 100mg「YD」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 9 年 12 月 22 日付 医薬審第 487 号、平成 13 年 5 月 31 日付 医薬審第 786 号及び平成 18 年 11 月 24 日付 薬食審査発第 1124004 号）」

試験方法：日局一般試験法「溶出試験第 2 法（パドル法）」による。

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH5.0 薄めた McIlvaine 緩衝液

pH6.8 日本薬局方溶出試験第 2 液

水 日本薬局方精製水

回転数：50rpm

IV. 製剤に関する項目

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って類似性を判定した。

【pH1.2、50rpm】、【pH5.0、50rpm】、【pH6.8、50rpm】：

標準製剤が15分～30分に平均85%以上溶出する場合

標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。

【水、50rpm】：

標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が85%以上になるとき、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。

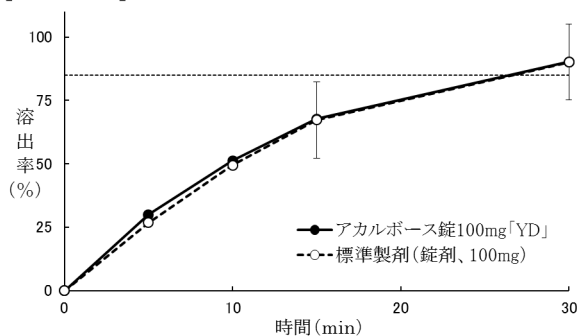
試験結果：すべての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

溶出挙動における類似性（アカルボース錠 100mg「YD」及び標準製剤の平均溶出率の比較）

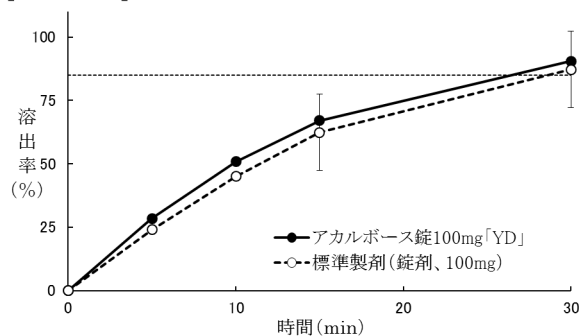
試験条件	溶出時間(分)	平均溶出率(%)			判定	判定基準 (アカルボース錠 100mg「YD」の溶出条件)
		アカルボース錠 100mg「YD」	標準製剤 (錠剤、100mg)	差 (絶対値)		
50rpm	pH1.2	15	67.7	67.3	0.4	±15%又はf2関数≥42
		30	90.2	90.1	0.1	
	pH5.0	15	67.1	62.4	4.7	
		30	90.5	87.2	3.3	
	pH6.8	15	65.7	67.3	1.6	
		30	88.5	91.2	2.7	
水	10	47.2	43.5	3.7		
	45	90.7	86.2	4.5		

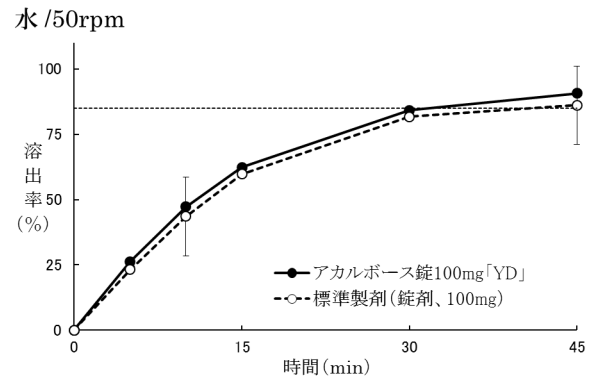
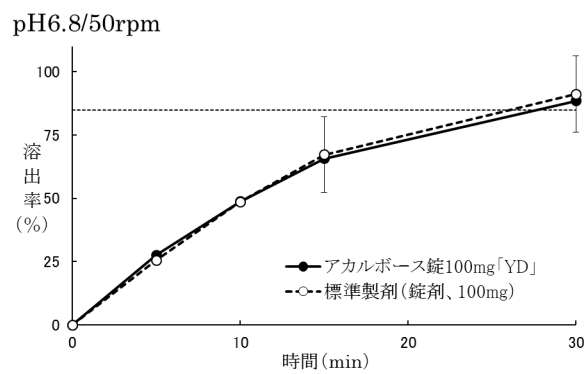
(溶出曲線)

pH1.2/50rpm



pH5.0/50rpm





8. 生物学的試験法

該当資料なし

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) フェーリング試液による沈殿反応
- (2) p-ベンゾキノン試液による呈色反応
- (3) 薄層クロマトグラフィー
- (4) 紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

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

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

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・運動療法によっても十分な血糖コントロールが得られない場合、又は食事療法・運動療法に加えて経口血糖降下薬若しくはインスリン製剤を使用している患者で十分な血糖コントロールが得られない場合に限る)

2. 用法及び用量

アカルボースとして、成人では通常1回100mgを1日3回、食直前に経口投与する。ただし、1回50mgより投与を開始し、忍容性を確認したうえ1回100mgへ増量することもできる。

なお、年齢、症状に応じ適宜増減する。

3. 臨床成績

(1)臨床データパッケージ(2009年4月以降承認品目)

該当資料なし

(2)臨床効果

該当資料なし

(3)臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4)探索的試験：用量反応探索試験

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

該当資料なし

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

α -グルコシダーゼ阻害剤（ボグリボース、ミグリトール）

2. 薬理作用

(1)作用部位・作用機序

該当資料なし

(2)薬効を裏付ける試験成績⁴⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審第487号、平成13年5月31日付医薬審第786号及び平成18年11月24日付薬食審第1124004号)」

1) アカルボース錠 50mg「YD」

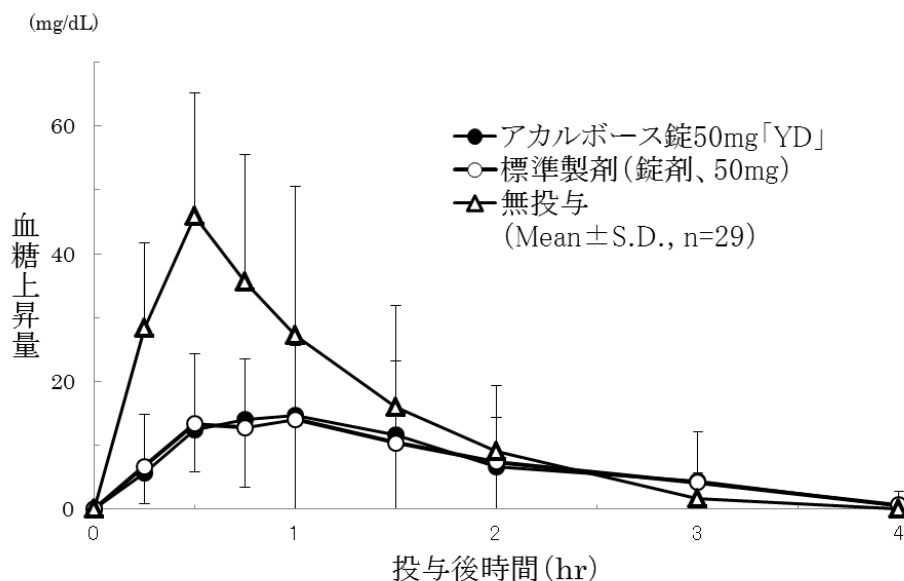
血糖上昇抑制作用（生物学的同等性試験）

アカルボース錠 50mg「YD」と標準製剤を健康成人男子29名にそれぞれ2錠（アカルボースとして100mg）、絶食単回経口投与し、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（100g）における血糖値の上昇量を経時的に測定した。その結果、無投与群に比較して両剤とも有意な血糖上昇抑制作用を示した。また、得られたパラメータ（AUC、 C_{max} ）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、 C_{max} ：最高血糖上昇量]

	AUC ₀₋₄ (mg・hr/dL)	C_{max} (mg/dL)
アカルボース錠 50mg「YD」	29.1±22.8	21.6±10.3
標準製剤（錠剤、50mg）	28.8±22.5	20.2±13.2

(Mean±S.D., n=29)



平均血糖値上昇量推移

血糖上昇量並びに AUC、 C_{max} 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。

2) アカルボース錠 100mg 「YD」

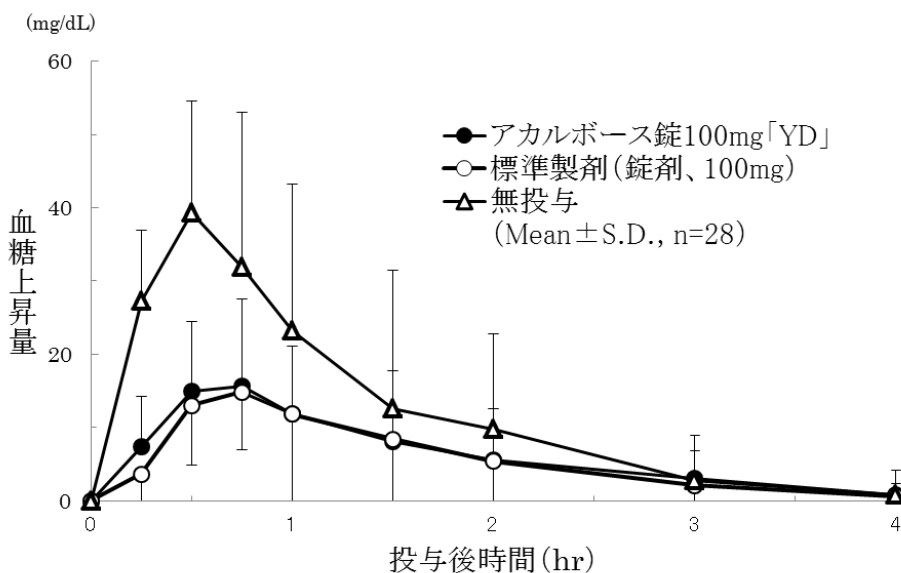
血糖上昇抑制作用（生物学的同等性試験）

アカルボース錠 100mg 「YD」と標準製剤を健康成人男子 28 名にそれぞれ 1 錠（アカルボースとして 100mg）、絶食単回経口投与し、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（100g）における血糖値の上昇量を経時的に測定した。その結果、無投与群に比較して両剤とも有意な血糖上昇抑制作用を示した。また、得られたパラメータ（AUC、 C_{max} ）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、 C_{max} ：最高血糖上昇量]

	AUC ₀₋₄ (mg・hr/dL)	C_{max} (mg/dL)
アカルボース錠 100mg 「YD」	25.6±22.1	19.7±10.7
標準製剤（錠剤、100mg）	22.9±17.8	18.6±8.4

(Mean±S.D, n=28)



平均血糖値上昇量推移

血糖上昇量並びに AUC、 C_{max} 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。

(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・測定法

(1)治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2)最高血中濃度到達時間

該当資料なし

(3)臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(4)中毒域

該当資料なし

(5)食事・併用薬の影響

該当資料なし

(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)コンパートメントモデル

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

該当資料なし

3. 吸 収

該当資料なし

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

該当資料なし

(3)乳汁への移行性

該当資料なし

<参考：動物>

「VIII.10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与(2)」の項を参照。

(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

該当資料なし

5. 代謝

(1)代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(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

(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

該当資料なし

(2)排泄率

該当資料なし

(3)排泄速度

該当資料なし

7. 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. 重症感染症、手術前後、重篤な外傷のある患者〔インスリン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. 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
4. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

1. 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されている患者〔併用により低血糖症状が発現することがある。〕
- (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、腸閉塞があらわれることがある。〕
- (3) 胃腸障害のある患者〔本剤の投与により鼓腸、放屁、下痢等の消化器症状を増強する可能性がある。〕
- (4) 重篤な肝機能障害のある患者〔代謝状態が不安定であり、血糖管理状況が大きく変化するおそれがある。〕
- (5) 重篤な腎機能障害のある患者〔外国においてクレアチニンクリアランス 25mL/min 未満の患者に投与した際の血中活性物質（本剤及び活性代謝物）濃度は腎機能正常者に比べて約 4～5 倍上昇することが報告されている。〕
- (6) ロエムヘルド症候群、重度のヘルニア、大腸の狭窄・潰瘍等のある患者〔腸内ガスの発生増加によって、症状が悪化することがある。〕
- (7) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

2. 重要な基本的注意

- (1) 他の糖尿病用薬と併用した場合に低血糖があらわれることがあるので、これらの薬剤との併用時には低用量から開始する、又は他の糖尿病用薬の用量を調整するなど慎重に投与すること。
- (2) 患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。
- (3) 劇症肝炎等の重篤な肝機能障害があらわれることがある。これらは投与開始後概ね6ヵ月以内に認められる場合が多いので、投与開始後6ヵ月までは月1回、その後も定期的に肝機能検査を行うこと。
- (4) 本剤の投与により、「腹部膨満・鼓腸」、「放屁増加」等の消化器系副作用が発現することがある。これらは、一般に時間の経過とともに消失することが多いが、症状に応じて減量あるいは消化管内ガス駆除剤の併用を考慮し、高度で耐えられない場合は投与を中止すること。
- (5) 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（腎性糖尿、老人性糖代謝異常、甲状腺機能異常等）を有する疾患があることに留意すること。
- (6) 本剤の投与は、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、食後血糖2時間値が200mg/dL以上を示す場合に限る。
- (7) 食事療法・運動療法に加えて経口血糖降下薬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。
- (8) 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薬若しくはインスリン製剤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。
- (9) 低血糖症状を起こすことがあるので、高所作業、自動車の運転等に従事している患者に投与するときには注意すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2)併用注意とその理由

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
スルホニルウレア系薬剤 グリベンクラミド グリクラジド 等 スルホンアミド系薬剤 グリブゾール ビグアナイド系薬剤 メトホルミン塩酸塩 ブホルミン塩酸塩 インスリン製剤 インスリン抵抗性改善剤 ピオグリタゾン塩酸塩 速効型食後血糖降下剤 ナテグリニド ミチグリニド	低血糖があらわれることがあるので、このような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。	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。
上記糖尿病用薬とそ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 等	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。	左記薬剤により他の糖尿病用薬の血糖降下作用が増強されるところに、本剤の糖質吸収遅延作用が加わる。
上記糖尿病用薬とそ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	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。	左記薬剤により他の糖尿病用薬の血糖降下作用が減弱されるところに、本剤の糖質吸収遅延作用が加わる。
ジゴキシン	本剤との併用によりジゴキシンの血中濃度が低下することがある。また、少数例で血中濃度の上昇も認められている。ジゴキシンの血中濃度が変動した場合には、ジゴキシンの投与量を調節するなど適切な処置を行う。	発現機序の詳細は不明である。
ラクツロース ラクチトール水和物	消化器系の副作用が増強される可能性がある。	左記薬剤が、本剤の作用による未消化の他の二糖類とともに下部消化管へと移行し、腸内細菌によって分解を受けることから、併用により腸内ガス等が更に増加する可能性がある。
炭水化物消化酵素製剤 ジアスターゼ 等	両剤の薬効に影響を及ぼす可能性がある。	本剤はα-アミラーゼ活性の阻害作用を有し、一方、炭水化物消化酵素製剤はα-アミラーゼ活性を有している。

8. 副作用

(1)副作用の概要

4. 副作用
本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2)重大な副作用と初期症状

4. 副作用
(1) 重大な副作用（頻度不明）
1) 低血糖：他の糖尿病用薬との併用で低血糖があらわれることがある。また、他の糖尿病用薬を併用しない場合でも低血糖が報告されている。本剤は二糖類の消化・吸収を遅延させるので、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。
2) 腸閉塞：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ので、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。
3) 肝機能障害、黄疸：AST（GOT）、ALT（GPT）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。また、劇症肝炎の報告がある。投与開始後6ヵ月までは月1回、その後も定期的に肝機能検査を行うなど観察を十分に行い、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。（「重要な基本的注意」の項参照）

4. 副作用
(2) 重大な副作用（類薬）
重篤な肝硬変例での意識障害を伴う高アンモニア血症：類薬（ボグリボース）で、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、意識障害を伴うとの報告があるので、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など適切な処置を行うこと。

(3)その他の副作用

4. 副作用
(3) その他の副作用
以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻 度 不 明
消 化 器	腹部膨満・鼓腸、放屁増加、排便回数増加、下痢、腹痛、便秘、嘔気、嘔吐、食欲不振、食欲亢進、軟便、消化不良、口渇、腸管のう腫状気腫症
過 敏 症 ^{注)}	発疹、そう痒
精神神経系	頭痛・頭重感、めまい、しびれ感
肝 臓 ^{注)}	AST（GOT）上昇、ALT（GPT）上昇、 γ -GTP上昇、ALP上昇、LDH上昇
血 液	貧血、白血球減少、血小板減少
そ の 他	浮腫、ほてり、胸部圧迫感、味覚異常、頻尿

注) 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

該当資料なし

(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. 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

4. 副作用

(3) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹、そう痒

注) 投与を中止すること。

9. 高齢者への投与

5. 高齢者への投与

高齢者等忍容性の低下が懸念される患者に対しては低用量（1回 50mg）から投与を開始し、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

6. 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投与しないこと。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (2) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましい。〔動物実験（授乳ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。〕

11. 小児等への投与

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は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

8. 適用上の注意

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。〕

15. その他の注意

9. その他の注意

外国での健康成人を対象としたコレステラミン製剤との併用試験において、本剤の効果（特に食後インスリン値の上昇の抑制）が増強されたとの報告がある。コレステラミン製剤は本剤の作用に影響を及ぼすおそれがあるので併用しないことが望ましい。

16. その他

IX. 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」参照）

(2)副次的薬理試験

該当資料なし

(3)安全性薬理試験

該当資料なし

(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

該当資料なし

(2)反復投与毒性試験

該当資料なし

(3)生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4)その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：処方せん医薬品（注意—医師等の処方せんにより使用すること）

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存

保管方法

- 1) 使用期限内であっても、アルミピロー開封後はなるべく速やかに使用すること。
- 2) 本剤は吸湿性が強いので、アルミピロー開封後は湿気を避けて保存し、服用直前まで PTP シートから取り出さないこと（一包化調剤は避けること）。

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1)薬局での取扱いについて

「X.3.貯法・保存条件」の項を参照。

(2)薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

PTP シートから錠剤を押し出す際には、過度の圧力が加わらないよう、爪を立てずに指の腹で押し出すこと。

「Ⅷ.14.適用上の注意」の項を参照。

5. 承認条件等

該当しない

6. 包 装

アカルボース錠 50mg 「YD」：（PTP） 100 錠（10 錠×10）

500 錠（10 錠×50）

アカルボース錠 100mg 「YD」：（PTP） 100 錠（10 錠×10）

500 錠（10 錠×50）

7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネート袋

化粧箱：紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分：グルコバイ錠 50mg、グルコバイ錠 100mg、グルコバイ OD 錠 50mg、グルコバイ OD 錠 100mg（バイエル薬品株式会社）

同 効 薬：ボグリボース、ミグリトール

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
アカルボース錠 50mg「YD」	2009年1月14日	22100AMX00218000
アカルボース錠 100mg「YD」	2009年1月14日	22100AMX00213000

11. 薬価基準収載年月日

2009年5月15日

12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

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

本剤は厚生労働大臣の定める「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT（9桁）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
アカルボース錠 50mg「YD」	119103503	3969003F1077	620009292
アカルボース錠 100mg「YD」	119104203	3969003F2073	620009297

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) (財)日本公定書協会編、医療用医薬品 品質情報集 2006;No.27:167, 薬事日報社
- 2) 社内資料 (安定性)
- 3) 社内資料 (溶出性)
- 4) 社内資料 (生物学的同等性)

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

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

該当資料なし

〔文献請求先・製品情報お問い合わせ先〕
第一三共エスファ株式会社 お客様相談室
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3-5-1
TEL:0120-100-601