

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領 2013 に準拠して作成

## 食後過血糖改善剤

# アカルボース錠 50mg 「JG」 アカルボース錠 100mg 「JG」

## Acarbose Tablets

剤形	錠剤（素錠）
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50mg：1錠中 アカルボース 50.0mg 含有 錠100mg：1錠中 アカルボース 100.0mg 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：日本ジェネリック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室 受付時間：9時～18時（土、日、祝日を除く） TEL 0120 - 893 - 170 FAX 0120 - 893 - 172 医療関係者向けホームページ： <a href="http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html">http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html</a>

本IFは2017年3月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、（独）医薬品医療機器総合機構（PMDA）ホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

# IF 利用の手引きの概要

—日本病院薬剤師会—

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

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

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

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

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

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

最新版の e-IF は、(独) 医薬品医療機器総合機構 (PMDA) ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する PMDA ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

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

## 2. IF とは

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

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

### 〔IF の様式〕

①規格は A 4 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。

- ② I F 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「I F 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。

#### 【I F の作成】

- ① I F 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。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F 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。

#### 【I F の発行】

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

### 3. I F の利用にあたって

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

電子媒体の I F については、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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、I F 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、I F 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、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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

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

(2013 年 4 月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	11. 力価	14
1. 開発の経緯	1	12. 混入する可能性のある夾雑物	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	15
II. 名称に関する項目	2	14. その他	15
1. 販売名	2	V. 治療に関する項目	16
(1)和名	2	1. 効能又は効果	16
(2)洋名	2	2. 用法及び用量	16
(3)名称の由来	2	3. 臨床成績	16
2. 一般名	2	(1)臨床データパッケージ	16
(1)和名(命名法)	2	(2)臨床効果	16
(2)洋名(命名法)	2	(3)臨床薬理試験	16
(3)ステム	2	(4)探索的試験	16
3. 構造式又は示性式	2	(5)検証的試験	16
4. 分子式及び分子量	2	1)無作為化並行用量反応試験	16
5. 化学名(命名法)	2	2)比較試験	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	3)安全性試験	16
7. CAS登録番号	3	4)患者・病態別試験	16
III. 有効成分に関する項目	4	(6)治療的使用	16
1. 物理化学的性質	4	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)	16
(1)外観・性状	4	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	16
(2)溶解性	4	VI. 薬効薬理に関する項目	17
(3)吸湿性	4	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	17
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点	4	2. 薬理作用	17
(5)酸塩基解離定数	4	(1)作用部位・作用機序	17
(6)分配係数	4	(2)薬効を裏付ける試験成績	17
(7)その他の主な示性値	4	(3)作用発現時間・持続時間	19
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	VII. 薬物動態に関する項目	20
3. 有効成分の確認試験法	4	1. 血中濃度の推移・測定法	20
4. 有効成分の定量法	4	(1)治療上有効な血中濃度	20
IV. 製剤に関する項目	5	(2)最高血中濃度到達時間	20
1. 剤形	5	(3)臨床試験で確認された血中濃度	20
(1)剤形の区別、外観及び性状	5	(4)中毒域	20
(2)製剤の物性	5	(5)食事・併用薬の影響	20
(3)識別コード	5	(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	20
(4)pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等	5	2. 薬物速度論的パラメータ	20
2. 製剤の組成	5	(1)解析方法	20
(1)有効成分(活性成分)の含量	5	(2)吸収速度定数	20
(2)添加物	5	(3)バイオアベイラビリティ	20
(3)その他	5	(4)消失速度定数	20
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5	(5)クリアランス	20
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	(6)分布容積	20
5. 調製法及び溶解後の安定性	10	(7)血漿蛋白結合率	20
6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	10		
7. 溶出性	10		
8. 生物学的試験法	14		
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	14		
10. 製剤中の有効成分の定量法	14		

3. 吸収	20	16. その他	27
4. 分布	20		
(1)血液-脳関門通過性	20		
(2)血液-胎盤関門通過性	20		
(3)乳汁への移行性	21		
(4)髄液への移行性	21		
(5)その他の組織への移行性	21		
5. 代謝	21		
(1)代謝部位及び代謝経路	21		
(2)代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分 子種	21		
(3)初回通過効果の有無及びその割合	21		
(4)代謝物の活性の有無及び比率	21		
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	21		
6. 排泄	21		
(1)排泄部位及び経路	21		
(2)排泄率	21		
(3)排泄速度	21		
7. トランスポーターに関する情報	21		
8. 透析等による除去率	21		
<b>VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目</b>	22		
1. 警告内容とその理由	22		
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	22		
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意 とその理由	22		
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意 とその理由	22		
5. 慎重投与内容とその理由	22		
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置 方法	23		
7. 相互作用	23		
(1)併用禁忌とその理由	23		
(2)併用注意とその理由	24		
8. 副作用	25		
(1)副作用の概要	25		
(2)重大な副作用と初期症状	25		
(3)その他の副作用	26		
(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値 異常一覧	26		
(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	26		
(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験 法	26		
9. 高齢者への投与	26		
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	26		
11. 小児等への投与	26		
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	26		
13. 過量投与	26		
14. 適用上の注意	27		
15. その他の注意	27		
		<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	28
		1. 薬理試験	28
		(1)薬効薬理試験(「VI.薬効薬理に関する項 目」参照)	28
		(2)副次的薬理試験	28
		(3)安全性薬理試験	28
		(4)その他の薬理試験	28
		2. 毒性試験	28
		(1)単回投与毒性試験	28
		(2)反復投与毒性試験	28
		(3)生殖発生毒性試験	28
		(4)その他の特殊毒性	28
		<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	29
		1. 規制区分	29
		2. 有効期間又は使用期限	29
		3. 貯法・保存条件	29
		4. 薬剤取扱い上の注意点	29
		(1)薬局での取り扱い上の留意点について	29
		(2)薬剤交付時の取扱いについて(患者等に 留意すべき必須事項等)	29
		(3)調剤時の留意点について	29
		5. 承認条件等	29
		6. 包装	29
		7. 容器の材質	30
		8. 同一成分・同効薬	30
		9. 国際誕生年月日	30
		10. 製造販売承認年月日及び承認番号	30
		11. 薬価基準収載年月日	30
		12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更 追加等の年月日及びその内容	30
		13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及 びその内容	30
		14. 再審査期間	30
		15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	30
		16. 各種コード	30
		17. 保険給付上の注意	30
		<b>XI. 文献</b>	31
		1. 引用文献	31
		2. その他の参考文献	31
		<b>XII. 参考資料</b>	32
		1. 主な外国での発売状況	32
		2. 海外における臨床支援情報	32
		<b>XIII. 備考</b>	33
		その他の関連資料	33

# I. 概要に関する項目

---

## 1. 開発の経緯

アカルボース錠50mg「JG」、アカルボース錠100mg「JG」は、アカルボースを含有する食後過血糖改善剤である。

アカルボースは微生物由来のオリゴ糖であり<sup>1)</sup>、 $\alpha$ -アミラーゼおよび $\alpha$ -グルコシダーゼを阻害する。<sup>2)</sup>

本邦では1993年に上市されている。

日本ジェネリック株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について(平成17年3月31日付薬食発第0331015号)」に基づき、規格及び試験方法を設定し、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2009年1月に製造販売承認を得て、2009年5月に上市した。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1)錠100mgは分割性を考慮した割線入り素錠である。

(2)PTPシートに「食直前に服用」の記載がされている。

(3)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の投与が必要である。

(4)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(頻度不明)。

また、類薬(ボグリボース)の投与により、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「JG」
- ・アカルボース錠100mg「JG」

#### (2)洋名

- ・Acarbose Tablets 50mg “JG”
- ・Acarbose Tablets 100mg “JG”

#### (3)名称の由来

「一般的名称」+「剤形」+「含量」+「屋号」より命名

### 2. 一般名

#### (1)和名(命名法)

アカルボース(JAN)

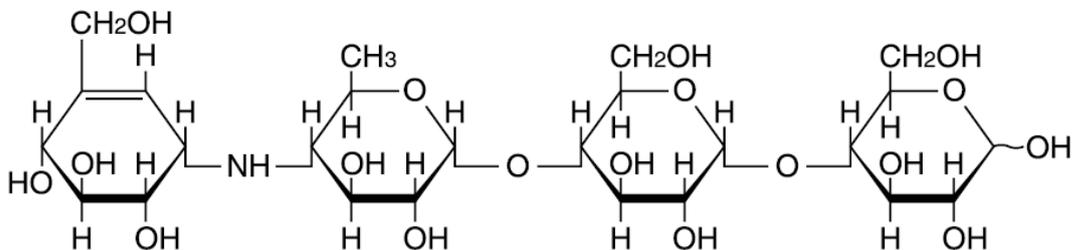
#### (2)洋名(命名法)

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：C<sub>25</sub>H<sub>43</sub>NO<sub>18</sub>

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]- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-*O*- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 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) <sup>3)</sup>	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

pKa : 5.1 (滴定法) <sup>3)</sup>

##### (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)

pH : 5.5~7.5(1→20)

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性 <sup>3)</sup>

安定性	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1,000lx)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：赤色の沈殿を生じる
- (2) *p*-ベンゾキノン試液による呈色反応：液は赤褐色を呈する
- (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、外観及び性状

販売名	アカルボース錠50mg「JG」	アカルボース錠100mg「JG」
色・剤形	白色～淡黄色の円形の錠剤	割線を有する白色～淡黄色の円形の錠剤
外形	  	  
大きさ (mm)	直径：6.0 厚さ：2.7	直径：8.0 厚さ：3.1
重量 (mg)	100	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「JG」  
錠剤本体ならびにPTPシート上に記載：JG F56
- ・アカルボース錠100mg「JG」  
錠剤本体ならびにPTPシート上に記載：JG F57

#### (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「JG」  
1錠中 アカルボース 50.0mg 含有
- ・アカルボース錠100mg「JG」  
1錠中 アカルボース 100.0mg 含有

#### (2) 添加物

- ・アカルボース錠50mg「JG」、アカルボース錠100mg「JG」  
トウモロコシデンプン、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム

#### (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

##### アカルボース錠50mg「JG」

###### ◎加速試験<sup>4)</sup>

包装形態：PTP包装（PTP/アルミピロー）

試験条件：40±1℃、75±5%RH

試験期間：6ヵ月

試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験、水分

試験項目	性状	確認試験				純度 試験	製剤均一 性試験	溶出 試験	定量 試験	水分
		(2)	(3)	(4)	(5)					
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	(8)	(9)	(10)
試験開始時	適合 (白色～淡黄色)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	99.6%	2.4%
1ヵ月後	適合 (淡黄色)	適合	適合	適合	—	適合	適合	適合	103.4%	2.4%
3ヵ月後	適合 (淡黄色)	適合	適合	適合	—	適合	適合	適合	100.9%	2.2%
6ヵ月後	適合 (淡黄色)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	99.7%	2.4%

(1)白色～淡黄色の円形の錠剤である。

(2)フェーリング試液による沈殿反応：赤色の沈殿を生じる。

(3)*p*-ベンゾキノン試液による呈色反応：液は赤褐色を呈する。

(4)薄層クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液から得たスポットのRf値は等しい。

(5)紫外可視吸光度測定法：波長340nmにおける吸光度 $A_T$ 及び $A_{BL}$ は同様の吸光度を示し、その値は $A_S$ より小さい。

(6)各類縁物質がそれぞれの規格値を超えず、かつ総類縁物質が3.0%以下である。

(7)質量偏差試験：判定値が15.0%を超えない。

(8)試験液に水900mLを用い、パドル法75rpmで試験を行うとき、15分間の溶出率は85%以上である。

(9)95.0～105.0%

(10)参考値

###### ◎長期保存試験<sup>5)</sup>

包装形態：PTP包装（PTP/アルミピロー）

試験条件：室温

試験期間：3年

試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験

試験項目	性状	確認試験			純度試験	製剤均一性試験	溶出試験	定量試験
		(2)	(3)	(4)				
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	(8)
試験開始時	適合 (白色)	適合	適合	適合	適合	適合	102.1%	102.0%
6ヵ月後	適合 (白色)	—	—	—	—	—	93.2%	103.3%
24ヵ月後	適合 (白色)	—	—	—	—	—	102%	104.1%
36ヵ月後	適合 (淡黄色)	適合	適合	適合	適合	適合	92%	99.9%

(1)白色～淡黄色の円形の錠剤である。

(2)フェーリング試液による沈殿反応：赤色の沈殿を生じる。

(3)*p*-ベンゾキノン試液による呈色反応：液は赤褐色を呈する。

(4)薄層クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液から得たスポットのRf値は等しい。

(5)各類縁物質がそれぞれの規格値を超えず、かつ総類縁物質が3.0%以下である。

(6)質量偏差試験：判定値が15.0%を超えない。

(7)試験液に水 900mL を用い、パドル法 75rpm で試験を行うとき、15 分間の溶出率は85%以上である。

(8)95.0～105.0%

長期保存試験（室温、3年）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。

#### ◎無包装状態での安定性<sup>6)</sup>

試験条件：①温度に対する安定性試験：40℃、3ヵ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：25℃/75%RH、3ヵ月（遮光・開放）

③光に対する安定性試験：総照度60万lux・hr（透明・気密容器）

試験項目：性状、硬度、溶出試験、定量試験

保存条件	性状	硬度	溶出試験	定量試験 <sup>注)</sup>
規格	(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時	白色の円形の錠剤	17N	102%	100.0%
①温度	変化あり（微黄色）	変化なし	変化なし	101.1%
②湿度	変化あり（微褐色）	変化あり (75N)	変化なし	101.1%
③光	変化なし	変化なし	変化なし	102.1%

(1)白色～淡黄色の円形の錠剤である。

(2)参考値

(3)試験液に水 900mL を用い、パドル法 50rpm で試験を行うとき、15 分間の溶出率は85%以上である。

(4)95.0～105.0%

注)試験開始時を100.0%とした残存率で示した

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）平成11年8月20日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

### アカルボース錠100mg「JG」

#### ◎加速試験<sup>7)</sup>

包装形態：PTP包装（PTP/アルミピロー）

試験条件：40±1℃、75±5%RH

試験期間：6ヵ月

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験、水分

試験項目	性状	確認試験				純度試験	製剤均一性試験	溶出試験	定量試験	水分
		(2)	(3)	(4)	(5)					
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	(8)	(9)	(10)
試験開始時	適合 (白色～淡黄色)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	101.3%	2.3%
1ヵ月後	適合 (淡黄色)	適合	適合	適合	—	適合	適合	適合	101.8%	2.5%
3ヵ月後	適合 (淡黄色)	適合	適合	適合	—	適合	適合	適合	99.5%	1.9%
6ヵ月後	適合 (淡黄色)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	98.5%	1.9%

(1)割線を有する白色～淡黄色の円形の錠剤である。

(2)フェーリング試液による沈殿反応：赤色の沈殿を生じる。

(3)*p*-ベンゾキノン試液による呈色反応：液は赤褐色を呈する。

(4)薄層クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液から得たスポットのRf値は等しい。

(5)紫外可視吸光度測定法：波長340nmにおける吸光度 $A_T$ 及び $A_{BL}$ は同様の吸光度を示し、その値は $A_S$ より小さい。

(6)各類縁物質がそれぞれの規格値を超えず、かつ総類縁物質が3.0%以下である。

(7)質量偏差試験：判定値が15.0%を超えない。

(8)試験液に水 900mL を用い、パドル法 75rpm で試験を行うとき、30 分間の溶出率は85%以上である。

(9)95.0～105.0%

(10)参考値

#### ◎長期保存試験<sup>8)</sup>

包装形態：PTP包装（PTP/アルミピロー）

試験条件：室温

試験期間：3年

試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験

試験項目	性状	確認試験			純度試験	製剤均一性試験	溶出試験	定量試験
		(2)	(3)	(4)				
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	(8)
試験開始時	適合 (白色)	適合	適合	適合	適合	適合	103.0%	102.3%
6ヵ月後	適合 (白色)	—	—	—	—	—	102.9%	103.3%
24ヵ月後	適合 (白色)	—	—	—	—	—	105%	103.9%
36ヵ月後	適合 (淡黄色)	適合	適合	適合	適合	適合	103%	99.8%

(1)割線を有する白色～淡黄色の円形の錠剤である。

(2)フェーリング試液による沈殿反応：赤色の沈殿を生じる。

(3)*p*-ベンゾキノン試液による呈色反応：液は赤褐色を呈する。

(4)薄層クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液から得たスポットのRf値は等しい。

(5)参考値（各類縁物質がそれぞれの規格値を超えず、かつ総類縁物質が3.0%以下である。）

(6)質量偏差試験：判定値が15.0%を超えない。

(7)試験液に水 900mL を用い、パドル法 75rpm で試験を行うとき、30 分間の溶出率は85%以上である。

(8)95.0～105.0%

長期保存試験（室温、3年）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。

#### ◎無包装状態での安定性<sup>9)</sup>

試験条件：①温度に対する安定性試験：40℃、3ヵ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：25℃/75%RH、3ヵ月（遮光・開放）

③光に対する安定性試験：総照度60万lux・hr（透明・気密容器）

試験項目：性状、硬度、溶出試験、定量試験

保存条件	性状	硬度	溶出試験	定量試験 <sup>注)</sup>
規格	(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時	割線を有する 白色の円形の錠剤	28N	103%	100.0%
①温度	変化あり（微黄色）	変化なし	変化なし	101.2%
②湿度	変化あり（微褐色）	変化あり (88N)	変化なし	101.0%
③光	変化なし	変化なし	変化なし	100.5%

(1)割線を有する白色～淡黄色の円形の錠剤である。

(2)参考値

(3)試験液に水 900mL を用い、パドル法 50rpm で試験を行うとき、15 分間の溶出率は85%以上である。

(4)95.0～105.0%

注)試験開始時を100.0%とした残存率で示した

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）平成11年8月20日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

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

【溶出挙動における類似性】

アカルボース錠50mg「JG」<sup>10)</sup>

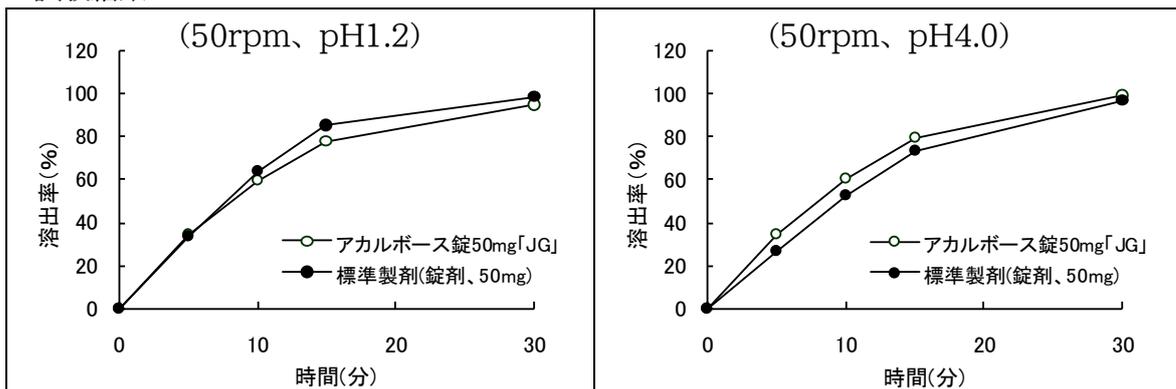
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号）」に準じる。

試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法）			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第1液
			pH4.0	薄めたMcIlvaineの緩衝液
			pH6.8	日本薬局方 溶出試験第2液
			水	日本薬局方 精製水
	100rpm	pH4.0	薄めたMcIlvaineの緩衝液	
試験液量：900mL 試験回数：12ベッセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

・判定基準

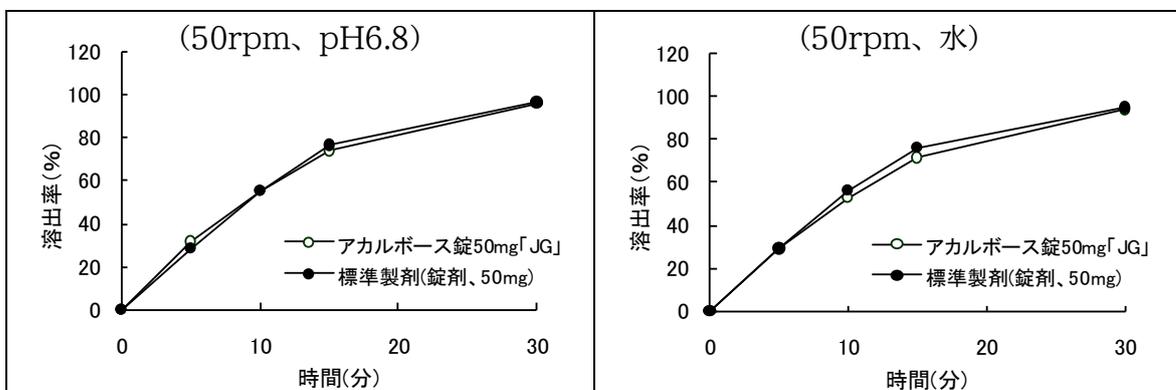
回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の溶出率±15%の範囲にある。
	pH4.0	標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近となる適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。
	pH6.8	
	水	
100rpm	pH4.0	試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の溶出率±15%の範囲にある。

・試験結果



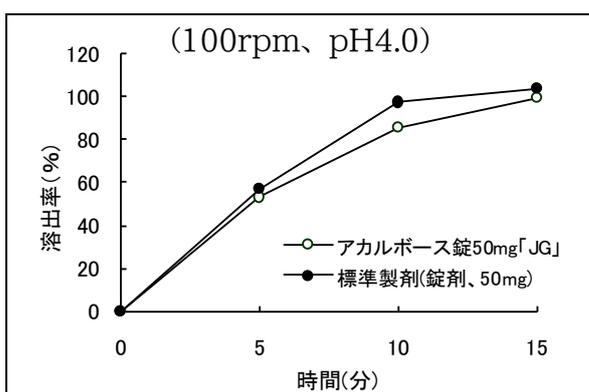
判定時点である15分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。

判定時点である10分及び15分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。



判定時点である10分及び15分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。

判定時点である10分及び15分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。



判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出し、ガイドラインの判定基準に適合した。

表 1. 溶出挙動の類似性の判定 (平均溶出率)

試験条件			平均溶出率 (%)		判定
回転数	試験液	判定時点 (min)	標準製剤 (錠剤、50mg)	試験製剤 (アカルボース錠 50mg「JG」)	
50rpm	pH1.2	15	85.1	77.7	適合
	pH4.0	10	53.0	60.8	適合
		15	73.3	79.6	
	pH6.8	10	55.5	55.5	適合
		15	76.5	73.9	
	水	10	56.2	53.1	適合
15		76.4	71.4		
100rpm	pH4.0	15	103.9	99.6	適合

・結論

標準製剤と試験製剤の平均溶出率を比較したところ、いずれの試験条件においても「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ていた。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動は類似性が確認された。

アカルボース錠 100mg「JG」<sup>11)</sup>

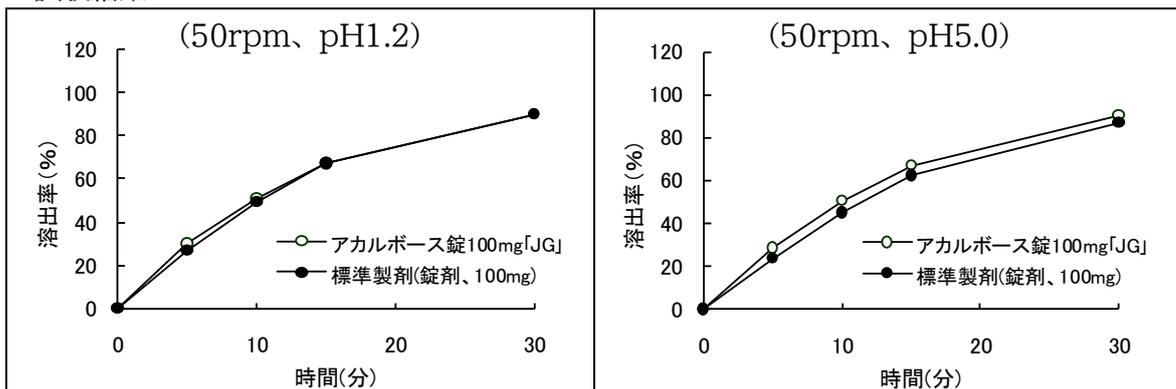
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について (平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号)」に準じる。

試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法 (パドル法)			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第1液
			pH5.0	薄めたMcIlvaineの緩衝液
			pH6.8	日本薬局方 溶出試験第2液
			水	日本薬局方 精製水
	100rpm	pH5.0	薄めたMcIlvaineの緩衝液	
試験液量：900mL 試験回数：12ベッセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

・判定基準

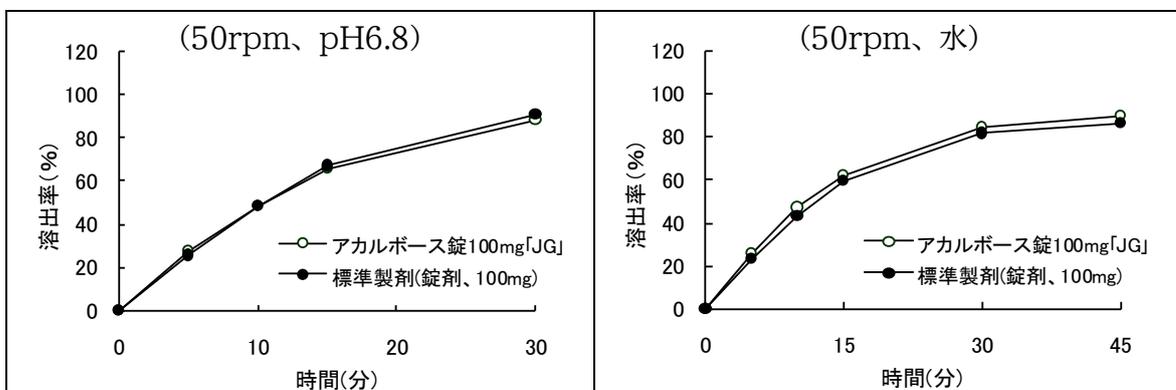
回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近となる適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。
	pH5.0	
	pH6.8	
	水	標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。
100rpm	pH5.0	試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の溶出率±15%の範囲にある。

・試験結果



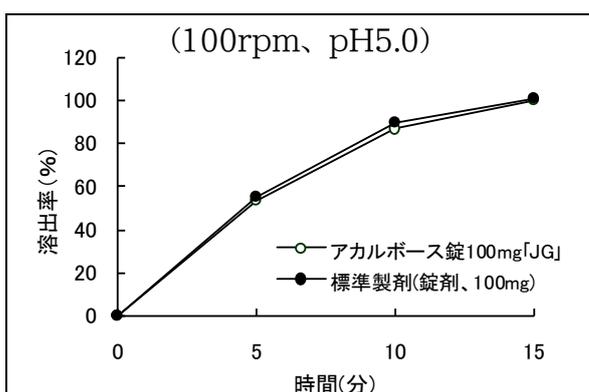
判定時点である15分及び30分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。

判定時点である15分及び30分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。



判定時点である15分及び30分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。

判定時点である10分及び45分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。



判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出し、ガイドラインの判定基準に適合した。

表 2. 溶出挙動の類似性の判定（平均溶出率）

試験条件			平均溶出率（％）		判定
回転数	試験液	判定時点 (min)	標準製剤 (錠剤、50mg)	試験製剤（アカルボース錠 50mg「JG」）	
50rpm	pH1.2	15	67.3	67.7	適合
		30	90.1	90.2	
	pH5.0	15	62.4	67.1	適合
		30	87.2	90.5	
	pH6.8	15	67.3	65.7	適合
		30	91.2	88.5	
水	10	43.5	47.2	適合	
	45	86.2	90.7		
100rpm	pH5.0	15	101.2	100.4	適合

・結論

標準製剤と試験製剤の平均溶出率を比較したところ、いずれの試験条件においても「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ていた。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動は類似性が確認された。

【公的溶出規格への適合】

アカルボース錠50mg「JG」及びアカルボース錠100mg「JG」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。

試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法）
試験条件	回転数：75rpm 試験液：水 試験液量：900mL
分析法	液体クロマトグラフィー
溶出規格	錠50mg：15分間85%以上、錠100mg：30分間85%以上

8. 生物学的試験法

該当しない

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

類縁物質A：

*O*-4,6-dideoxy-4-[[*(1S,4R,5S,6S)*-4,5,6-trihydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]amino]- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-*O*- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-D-arabino-hex-2-ulopyranose

類縁物質B：

*(1R,4R,5S,6R)*-4,5,6-trihydroxy-2-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl 4-*O*-[4,6-dideoxy-4-[[*(1S,4R,5S,6S)*-4,5,6-trihydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]amino]- $\alpha$ -D-glucopyranosyl]- $\alpha$ -D-glucopyranoside

類縁物質C：

$\alpha$ -D-glucopyranosyl 4-*O*-[4,6-dideoxy-4-[[*(1S,4R,5S,6S)*-4,5,6-trihydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]amino]- $\alpha$ -D-glucopyranosyl]- $\alpha$ -D-glucopyranoside

類縁物質D：

4-D-[4,6-dideoxy-4-[[*(1S,4R,5S,6S)*-4,5,6-trihydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]amino]- $\alpha$ -D-glucopyranosyl]-D-glucopyranose

類縁物質E：

*O*-4,6-dideoxy-4-[[*(1S,4R,5S,6S)*-4,5,6-trihydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]amino]- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-*O*- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-D-arabino-hex-2-ulopyranose

類縁物質F：

*O*-4,6-dideoxy-4-[[*(1S,4R,5S,6S)*-4,5,6-trihydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]amino]- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-*O*- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-*O*- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-D-glucopyranose

類縁物質G：

$\alpha$ -D-glucopyranosyl *O*-4,6-dideoxy-4-[[*(1S,4R,5S,6S)*-4,5,6-trihydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]amino]- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-*O*- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-*O*- $\alpha$ -D-glucopyranoside

類縁物質H：

*O*-4,6-dideoxy-4-[[*(1S,4R,5S,6S)*-4,5,6-trihydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]amino]- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-*O*-6-deoxy- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-D-glucopyranose

## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

## 14. その他

該当資料なし

## 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で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

該当資料なし

#### (2)臨床効果

該当資料なし

#### (3)臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4)探索的試験

該当資料なし

#### (5)検証的試験

##### 1)無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2)比較試験

該当資料なし

##### 3)安全性試験

該当資料なし

##### 4)患者・病態別試験

該当資料なし

#### (6)治療的使用

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

該当資料なし

##### 2)承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

$\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤：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

アカルボースは小腸粘膜微絨毛膜に存在する $\alpha$ -グルコシダーゼ(グルコアミラーゼ、スクラーゼ、マルターゼ)を用量依存的に阻害するほか、膵液及び唾液の $\alpha$ -アミラーゼを阻害し、食後の著しい血糖上昇を抑制する。

#### (2)薬効を裏付ける試験成績

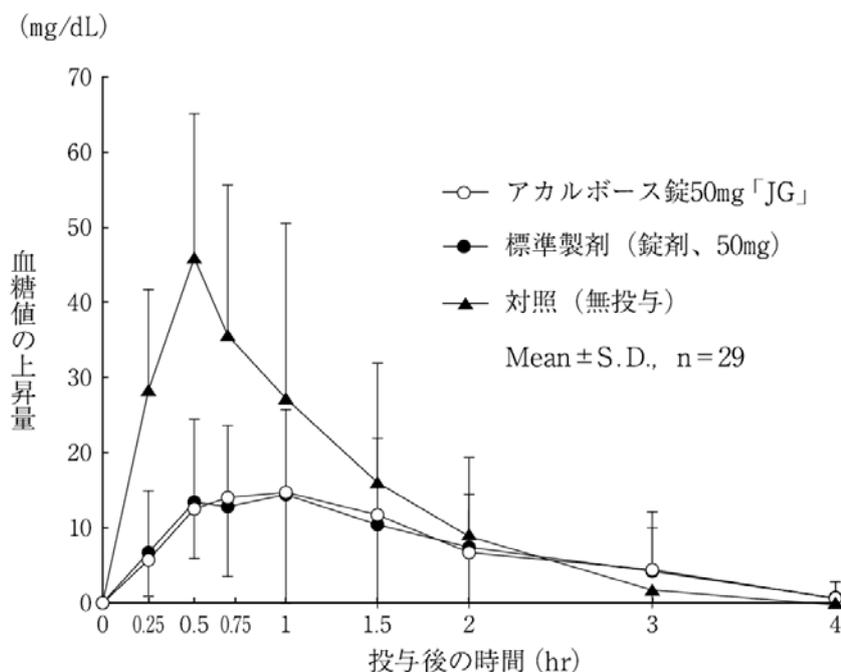
##### 【薬力学的同等性試験】

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号)」に準じる。

#### アカルボース錠50mg「JG」<sup>12)</sup>

アカルボース錠50mg「JG」と標準製剤を、それぞれ2錠(アカルボースとして100mg)健康成人男子に絶食単回経口投与し、無投与群を含む3群をクロスオーバー法により、ショ糖負荷(100g)による血糖値の上昇量を測定した。得られたパラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

[AUC：血糖値の上昇量-時間曲線下面積、Cmax：最高血糖上昇量]



<薬物動態パラメータ>

	判定パラメータ	
	AUC <sub>0-4</sub> (mg・hr/dL)	Cmax (mg/dL)
アカルボース錠 50mg「JG」	29.10±22.79	21.57±10.25
標準製剤(錠剤、50mg)	28.84±22.51	20.22±13.22

(Mean±S.D., n=29)

血糖値並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

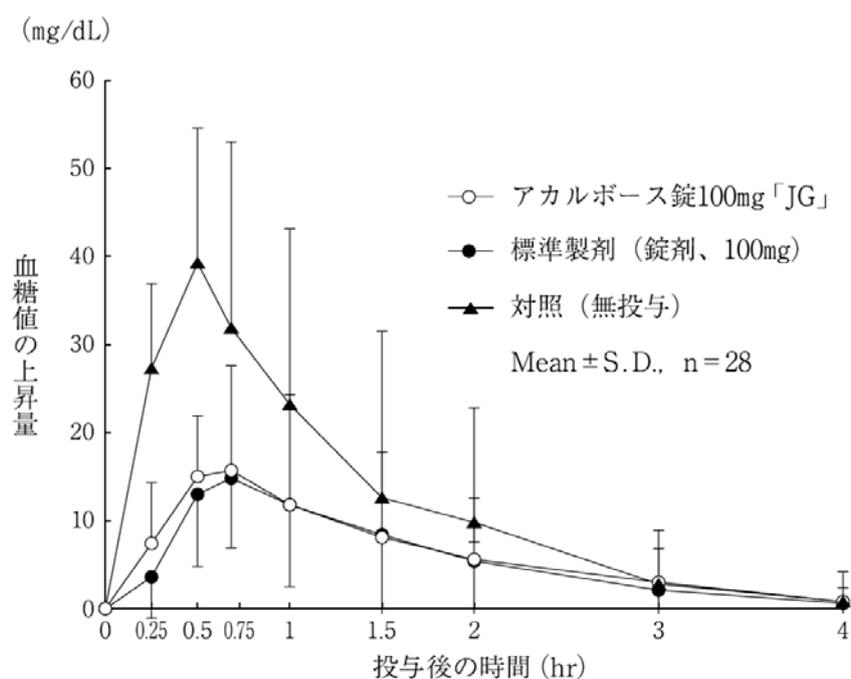
<同等性の判定結果>

	AUC <sub>0-4</sub>	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log (1.0534)	log (1.0639)
90%信頼区間	log(0.7391)~log(1.5014)	log(0.8416)~log(1.345)

アカルボース錠100mg「JG」<sup>13)</sup>

アカルボース錠100mg「JG」と標準製剤を、それぞれ1錠（アカルボースとして100mg）健康成人男子に絶食単回経口投与し、無投与群を含む3群をクロスオーバー法により、ショ糖負荷（100g）による血糖値の上昇量を測定した。得られたパラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

[AUC：血糖値の上昇量－時間曲線下面積、Cmax：最高血糖上昇量]



<薬物動態パラメータ>

	判定パラメータ	
	AUC <sub>0-4</sub> (mg・hr/dL)	Cmax (mg/dL)
アカルボース錠 100mg「JG」	25.58±22.05	19.73±10.72
標準製剤(錠剤、100mg)	22.89±17.82	18.61±8.40

(Mean±S.D., n=28)

血糖値並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

<同等性の判定結果>

	AUC <sub>0-4</sub>	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log (1.0803)	log (1.0599)
90%信頼区間	log (0.7548) ~ log (1.5461)	log (0.8365) ~ log (1.343)

(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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 -7.相互作用、-15.その他の注意」の項参照

#### (6) 母集団(ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

#### (4) 消失速度定数

該当資料なし

#### (5) クリアランス

該当資料なし

#### (6) 分布容積

該当資料なし

#### (7) 血漿蛋白結合率

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**

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 -10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

**(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. トランスポーターに関する情報**

該当資料なし

**8. 透析等による除去率**

該当資料なし

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

#### 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) 重症ケトosis、糖尿病性昏睡又は前昏睡の患者〔輸液及びインスリンによる速やかな高血糖の是正が必須となるので本剤の投与は適さない〕
- (2) 重症感染症、手術前後、重篤な外傷のある患者〔インスリン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

#### 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

### 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

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 プホルミン塩酸塩 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。
ジゴキシシン	本剤との併用によりジゴキシ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。ジゴキシシンの血中濃度が変動した場合には、ジゴキシ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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ラクツロース ラクチオール水和物	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 $\alpha$ -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 $\alpha$ -アミラーゼ活性を有している。

## 8. 副作用

### (1)副作用の概要

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

#### (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）

#### (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

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。太字の副作用については投与を中止すること。

	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、腸管囊腫状気腫症
過敏症	<b>発疹、痒痒</b>
精神神経系	頭痛・頭重感、めまい、しびれ感
肝臓	<b>AST(GOT)、ALT(GPT)、<math>\gamma</math>-GTP、ALP、LDH上昇</b>
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

### (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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 -2.禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）(3)、-8. 副作用(3)その他の副作用「過敏症」の項参照

## 9. 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

- (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

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

本剤服用中に血清1,5-AG（1,5 -アンヒドログルシトール）低値を示すことがある。1,5-AG の検査結果は、血糖コントロールの参考とはならないので注意すること。

## 13. 過量投与

該当しない

#### 14. 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

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

該当しない

## 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	アカルボース錠50mg「JG」 アカルボース錠100mg「JG」	処方箋医薬品※
有効成分	アカルボース	該当しない

※注意—医師等の処方箋により使用すること

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存、気密容器

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1)薬局での取り扱い上の留意点について

【取扱い上の注意】

##### 保存方法

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。

#### (2)薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

「Ⅶ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法、  
- 14. 適用上の注意」の項参照

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

「XⅢ. 備考 - その他の関連資料」の項参照

#### (3)調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

- ・アカルボース錠50mg「JG」  
PTP：100錠（10錠×10）、500錠（10錠×50）
- ・アカルボース錠100mg「JG」  
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（PTP）、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フィルム（ピロー）、紙箱

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：グルコバイ®錠50mg/錠100mg（バイエル薬品）他  
同効薬：ボグリボース、ミグリトール

9. 国際誕生年月日

該当しない

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「JG」	2009年1月14日	22100AMX00216000
アカルボース錠100mg「JG」	2009年1月14日	22100AMX00211000

11. 薬価基準収載年月日

2009年5月15日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

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、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

	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50m「JG」	119055701	3969003F1050	620009289
アカルボース錠100mg「JG」	119056401	3969003F2057	620009294

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

# X I . 文献

---

## 1. 引用文献

- 1)高折修二 他監訳：グッドマン・ギルマン薬理学（下）第10版：2179（2003）、廣川書店
- 2)田中千賀子、加藤隆一編集；NEW薬理学（改訂第6版）、503（2011）、南江堂
- 3)日本版オレンジブック研究会  
オレンジブック総合版 <http://www.jp-orangebook.gr.jp/index.html>
- 4)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠50mg「JG」の安定性試験（2009）
- 5)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠50mg「JG」の長期保存試験（2012）
- 6)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠50mg「JG」の無包装状態での安定性試験（2009）
- 7)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠100mg「JG」の安定性試験（2009）
- 8)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠100mg「JG」の長期保存試験（2012）
- 9)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠100mg「JG」の無包装状態での安定性試験（2009）
- 10)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠50mg「JG」の溶出試験（2009）
- 11)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠100mg「JG」の溶出試験（2009）
- 12)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠50mg「JG」の生物学的同等性試験（2009）
- 13)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
アカルボース錠100mg「JG」の生物学的同等性試験（2009）

## 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米FDA、オーストラリア分類とは異なる。

【使用上の注意】「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〕

	分類
FDA : Pregnancy Category	B (2010年3月)
オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	B3 (2013年4月)

参考：分類の概要

FDA : Pregnancy Category

B : Animal reproduction studies have failed to demonstrate a risk to the fetus, but there are no adequate and wellcontrolled studies of pregnant women. Or animal studies demonstrate a risk, and adequate and well-controlled studies in pregnant women have not been done during the first trimester.

オーストラリアの分類：

(An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

B3: Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed. Studies in animals have shown evidence of an increased occurrence of fetal damage, the significance of which is considered uncertain in humans.

# XIII. 備考

## その他の関連資料 患者様用指導箋

**アカルボース錠 50mg「JG」**  
**アカルボース錠 100mg「JG」** を服用される患者さまへ

アカルボース錠 50mg「JG」	アカルボース錠 100mg「JG」

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。以下の点についてご注意ください。  
この注意は必ず家族や周りの方にも知らせておいてください。

- 1. 薬の服用時間について**  
この薬は**食事の直前にお飲みください**。ごはんやパンなどの食べ物とまざりあって効く薬ですので、**食事の直前にお飲みください**。  
もし食事の直前に飲み忘れたときには、**食事中にお飲みください**。食後にお飲みになると効果が弱くなります。
- 2. 肝臓の機能への影響について**  
肝臓の機能の悪化防止には、早期発見と適切な対応が必要です。飲み始めた最初の6ヵ月間は毎月、その後も定期的に**肝機能検査**を行うことがあります。  
次の症状があらわれれば必ず主治医にご相談ください。  
●全身かたるい ●食欲がない  
●吐き気がする ●褐色尿  
●皮膚や白目が黄色くなる  
●体がかゆい ●発疹  
●発熱 など  
  
体のだるさ 皮膚や白目が黄色くなる
- 3. 腹部の症状について**  
この薬を飲み始めたときには、**おなかが張ったり、おならの回数が増えることなどがあります**。1、2ヵ月飲み続けるうちに、このような不快な症状は減少してくることが多いのですが、症状が強い、腹痛を伴うなど特に気になる場合は主治医または薬剤師にご相談ください。  
(薬量も必ずお読みください)

- 4. 低血糖について**  
**低血糖とは**  
◆血液中の糖分が少なくなりすぎた状態で、急に強い異常な空腹感や、力の抜けた感じ、冷や汗、手足のふるえ、目のちらつき等が起こったり、頭が痛かったり、ぼんやりしたり、ふらついたり、いつもと人柄の違ったような異常な行動をとることもあります。はなはだし場合には、けいれんを起こしたり意識を失うこともあります。  
◆空腹時に起こりやすく、食べ物をとると急速によくなるのが特徴です。  
◆低血糖は危険な状態ですから、もし起こったら軽いうちに治してしまわなければなりません。軽いうちはブドウ糖をとると治ります。  
  
手足のふるえ 冷や汗・動悸
- 1) この薬を服用しているときに低血糖が起こったら**  
◆必ずブドウ糖をとってください。この薬は砂糖などの二糖類の吸収を遅らせます。ほかの糖尿病の薬で起こった低血糖には効果のある**砂糖やあめ玉はこの薬をお飲みの時には、不十分です**。  
◆いつもブドウ糖を携帯してください。低血糖になっても、軽いうちはブドウ糖をとると治ります。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**5~10gのブドウ糖**をとってください。携帯用ブドウ糖については、主治医または薬剤師にご相談ください。  
◆低血糖が起こったら、早めに主治医に報告してください。
- 2) 低血糖を起こさないために**  
◆薬の飲み方は主治医の指導を正しく守ってください。  
◆食事量を減らしたり、抜いたりしないよう食事療法はきちんと守ることが大切です。  
◆お酒の飲み過ぎ、激しい運動などは低血糖を起こしやすくなりますので主治医の指導を正しく守ってください。
- 3) 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、低血糖を起こすと事故につながります。特に注意してください。**
- 5. その他、不快な症状が気になる場合は主治医または薬剤師にご相談ください。**

ACARB-PG-001-DK

*Memo*



**日本ジェネリック株式会社**

東京都千代田区丸の内一丁目 9 番 1 号