

**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  
アカルボース錠  
アカルボース錠 50mg 「NIG」  
アカルボース錠 100mg 「NIG」  
Acarbose Tablets**

剤形	素錠		
製剤の規制区分	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		
規格・含量	50mg：1 錠中アカルボース 50mg 含有 100mg：1 錠中アカルボース 100mg 含有		
一般名	和名：アカルボース 洋名：Acarbose		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始 年月日		錠 50mg	錠 100mg
	製造販売承認	2014 年 2 月 3 日	2013 年 11 月 21 日
	薬価基準収載	2022 年 12 月 9 日	2022 年 12 月 9 日
	販売開始	2007 年 7 月 6 日	2007 年 7 月 6 日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売：武田薬品工業株式会社 発売元：日医工株式会社 製造販売元：日医工岐阜工場株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>		

**本 IF は 2023 年 9 月改訂（第 1 版）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。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

## 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（<https://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・表現には薬機法の広告規則や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、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を活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。

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>14</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ...	14
2. 製品の治療学的特性.....	1	2. 薬理作用.....	14
3. 製品の製剤学的特性.....	1	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>17</b>
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	1	1. 血中濃度の推移.....	17
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	1	2. 薬物速度論的パラメータ.....	17
6. RMP の概要.....	1	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	17
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	4. 吸収.....	17
1. 販売名.....	2	5. 分布.....	17
2. 一般名.....	2	6. 代謝.....	18
3. 構造式又は示性式.....	2	7. 排泄.....	18
4. 分子式及び分子量.....	2	8. トランスポーターに関する情報.....	18
5. 化学名（命名法）又は本質.....	2	9. 透析等による除去率.....	18
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	2	10. 特定の背景を有する患者.....	18
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>3</b>	11. その他.....	18
1. 物理化学的性質.....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>19</b>
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	3	1. 警告内容とその理由.....	19
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	3	2. 禁忌内容とその理由.....	19
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>4</b>	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...	19
1. 剤形.....	4	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ...	19
2. 製剤の組成.....	4	5. 重要な基本的注意とその理由.....	19
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	5	6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	20
4. 力価.....	5	7. 相互作用.....	21
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	5	8. 副作用.....	21
6. 製剤の各種条件下における安定性.....	5	9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	22
7. 調製法及び溶解後の安定性.....	8	10. 過量投与.....	22
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）.....	8	11. 適用上の注意.....	23
9. 溶出性.....	8	12. その他の注意.....	23
10. 容器・包装.....	10	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>24</b>
11. 別途提供される資材類.....	11	1. 薬理試験.....	24
12. その他.....	11	2. 毒性試験.....	24
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>12</b>	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>25</b>
1. 効能又は効果.....	12	1. 規制区分.....	25
2. 効能又は効果に関連する注意.....	12	2. 有効期間.....	25
3. 用法及び用量.....	12	3. 包装状態での貯法.....	25
4. 用法及び用量に関連する注意.....	12	4. 取扱い上の注意点.....	25
5. 臨床成績.....	12	5. 患者向け資材.....	25

## 略語表

6.	同一成分・同効薬.....	25
7.	国際誕生年月日 .....	25
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.....	25
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.....	25
10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	26
11.	再審査期間 .....	26
12.	投薬期間制限に関する情報.....	26
13.	各種コード .....	26
14.	保険給付上の注意 .....	26
<b>X I.</b>	<b>文献</b> .....	<b>27</b>
1.	引用文献 .....	27
2.	その他の参考文献.....	27
<b>X II.</b>	<b>参考資料</b> .....	<b>28</b>
1.	主な外国での発売状況.....	28
2.	海外における臨床支援情報 .....	29
<b>X III.</b>	<b>備考</b> .....	<b>30</b>
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.....	30
2.	その他の関連資料.....	33

略語	略語内容
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
SD	標準偏差
TLC	薄層クロマトグラフィー
UV	紫外可視吸光度測定法

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、アカルボースを有効成分とする食後過血糖改善剤である。

「アカルボース錠 50mg「タイヨー）」及び「アカルボース錠 100mg「タイヨー）」は、武田テバファーマ株式会社（旧 大洋薬品工業株式会社）が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2006年3月15日に承認を取得し、2007年7月6日に販売を開始した。（医薬発第481号（平成11年4月8日）に基づき承認申請）

以下の販売名変更を行った。

承認年月日	販売名	旧販売名
2013年11月21日	アカルボース錠 100mg「テバ」	アカルボース錠 100mg「タイヨー」
2014年2月3日	アカルボース錠 50mg「テバ」	アカルボース錠 50mg「タイヨー」

2022年12月1日、「アカルボース錠 50mg「テバ）」及び「アカルボース錠 100mg「テバ）」は武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「テバ」から「NIG」に変更した。

2022年12月9日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、アカルボースを有効成分とする食後過血糖改善剤である。
- (2) 重大な副作用として、低血糖、腸閉塞、肝機能障害、黄疸、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。（「VIII.8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

### 3. 製品の製剤学的特性

- (1) PTPシートのウラ面に「糖尿病用薬」、「食直前に服用」と表記した。

### 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材、 最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として 作成されている資材	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	無	

### 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

アカルボース錠 50mg 「NIG」

アカルボース錠 100mg 「NIG」

#### (2) 洋名

Acarbose Tablets

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

アカルボース（JAN）

#### (2) 洋名（命名法）

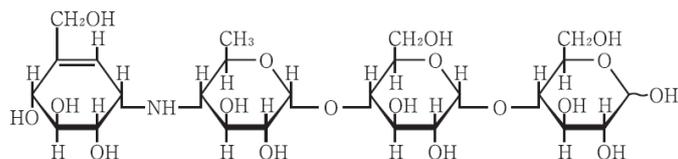
Acarbose（JAN）

#### (3) ステム（stem）

不明

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式：



### 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）又は本質

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

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

### 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、エタノール（95）に溶けにくく、1-ブタノールに極めて溶けにくく、アセトニトリル、アセトン、酢酸エチル、ジエチルエーテル、ジクロロメタン又はヘキサンにほとんど溶けない。

##### (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

該当資料なし

##### (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°（無水物に換算したもの 0.25g、水、25mL、100mm）  
本品1.0gを水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

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

##### (1) 確認試験法

###### 1) 沈殿反応

本品の水溶液を沸騰フェーリング試液に加えるとき、赤色の沈澱を生じる。

###### 2) 呈色反応

本品に水及びp-ベンゾキノン試液を加え、煮沸・冷却するとき、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により試験を行い、本品のスペクトルと標準品のスペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

##### (2) 定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：アセトニトリル、リン酸二水素カリウム、リン酸水素二ナトリウム二水和物、水混液

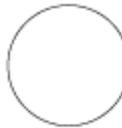
#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別

素錠

###### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	アカルボース錠 50mg 「NIG」	アカルボース錠 100mg 「NIG」
色・剤形	白色～淡黄色の素錠	白色～淡黄色の片面 1/2 割線入り素錠
外形		
		
		
直径	7.0mm	9.0mm
厚さ	3.0mm	3.8mm
質量	120mg	240mg
識別コード (PTP)	t 601	t 602

###### (3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

###### (4) 製剤の物性

(「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

###### (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

販売名	アカルボース錠 50mg 「NIG」	アカルボース錠 100mg 「NIG」
有効成分	1錠中：アカルボース 50mg	1錠中：アカルボース 100mg
添加剤	クロスボビドン、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、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

該当資料なし

### (3) 熱量

該当資料なし

### 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

該当資料なし

### 6. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

#### (1) 加速試験

試験実施期間：2009/6/19～2010/1/14

◇アカルボース錠 50mg「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態：PTP+アルミ袋]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 ヶ月	4 ヶ月	6 ヶ月
性状 n=3 <sup>*1</sup> <白色～淡黄色の素錠>	09F16A 09F16B 09F16C	適合	適合	適合	適合
確認試験 n=3 (TLC、UV)	09F16A 09F16B 09F16C	適合	—	—	適合
純度試験 n=3 <※1>	09F16A 09F16B 09F16C	適合	適合	適合	適合
製剤均一性 n=3 <15%以下>	09F16A 09F16B 09F16C	適合	—	—	適合
溶出性 (%) n=3 <15分、85%以上>	09F16A 09F16B 09F16C	96～108	95～107	96～107	95～105
含量 (%) <sup>*2</sup> n=3 <95.0～105.0%>	09F16A 09F16B 09F16C	100.6±1.4 <sup>*3</sup>	99.3±1.6 <sup>*3</sup>	99.0±1.0 <sup>*3</sup>	98.5±1.2 <sup>*3</sup>

※1：個々の類縁物質：3.0%以下、総類縁物質：6.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

※3：平均値±標準偏差 (SD)

—：未実施

試験実施期間：2009/6/19～2010/1/14

◇アカルボース錠 100mg「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態：PTP+アルミ袋]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 ヶ月	4 ヶ月	6 ヶ月
性状 n=3 ＜白色～淡黄色の片面1/2割 線入りの素錠＞	09F16D 09F16E 09F16F	適合	適合	適合	適合
確認試験 n=3 (TLC、UV)	09F16D 09F16E 09F16F	適合	—	—	適合
純度試験 n=3 ＜※1＞	09F16D 09F16E 09F16F	適合	適合	適合	適合
製剤均一性 n=3 ＜15%以下＞	09F16D 09F16E 09F16F	適合	—	—	適合
溶出性 (%) n=3 ＜30分、85%以上＞	09F16D 09F16E 09F16F	97～110	98～109	97～106	96～107
含量 (%) ※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	09F16D 09F16E 09F16F	101.0±1.3※3	100.3±0.7※3	99.0±1.0※3	98.9±0.9※3

※1：個々の類縁物質：3.0%以下、総類縁物質：6.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%) ※3：平均値±標準偏差 (SD) —：未実施

(2) 無包装状態の安定性

◇アカルボース錠 50mg「NIG」 無包装 40℃ [遮光・気密容器]

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	白色	微黄白色
溶出性 (%) ＜15分、85%以上＞	98～103	99～108
残存率 (%)	100	98
(参考値) 硬度 (kg)	5.0	4.3

◇アカルボース錠 50mg「NIG」 無包装 25℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	白色	わずかに褐色を帯びた白色※
溶出性 (%) ＜15分、85%以上＞	98～103	97～112
残存率 (%)	100	100
(参考値) 硬度 (kg)	5.0	7.7

※：不均一に着色

◇アカルボース錠 50mg「NIG」 無包装 25℃・60%RH 曝光 [散光・気密容器]

試験項目 ＜規格＞	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx・hr
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	白色	白色
溶出性 (%) ＜15 分、85%以上＞	98～103	98～100
残存率 (%)	100	99
(参考値) 硬度 (kg)	5.0	4.5

◇アカルボース錠 100mg「NIG」 無包装 40℃ [遮光・気密容器]

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の片面 1/2 割線 入りの素錠＞	白色	微黄白色
溶出性 (%) ＜30 分、85%以上＞	99.6～102.7	99.5～102.1
残存率 (%)	100	99.6
(参考値) 硬度 (kg)	9.5	10.6

◇アカルボース錠 100mg「NIG」 無包装 25℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の片面 1/2 割線 入りの素錠＞	白色	わずかに褐色を帯びた白色※
溶出性 (%) ＜30 分、85%以上＞	99.6～102.7	97.6～101.2
残存率 (%)	100	99.4
(参考値) 硬度 (kg)	9.5	11.2

※：不均一に着色

◇アカルボース錠 100mg「NIG」 無包装 25℃・60%RH 曝光 [散光・気密容器]

試験項目 <規格>	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx・hr
性状 <白色～淡黄色の片面 1/2 割線 入りの素錠>	白色	白色
溶出性 (%) <30 分、85%以上>	99.6～102.7	98.3～100.8
残存率 (%)	100	99.9
(参考値) 硬度 (kg)	9.5	9.5

## 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）

該当しない

## 9. 溶出性

### (1) 溶出規格

アカルボース錠 50mg「NIG」及びアカルボース錠 100mg「NIG」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 (50mg 錠、100mg 錠) の溶出試験に適合していることが確認されている。

(試験液に水 900mL を用い、パドル法により、75rpm で試験を行う)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
50mg	15 分	85%以上
100mg	30 分	85%以上

(2) 溶出試験<sup>2)</sup>

〈アカルボース錠 50mg 「NIG」〉

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13年5月31日 医薬審発第786号)

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

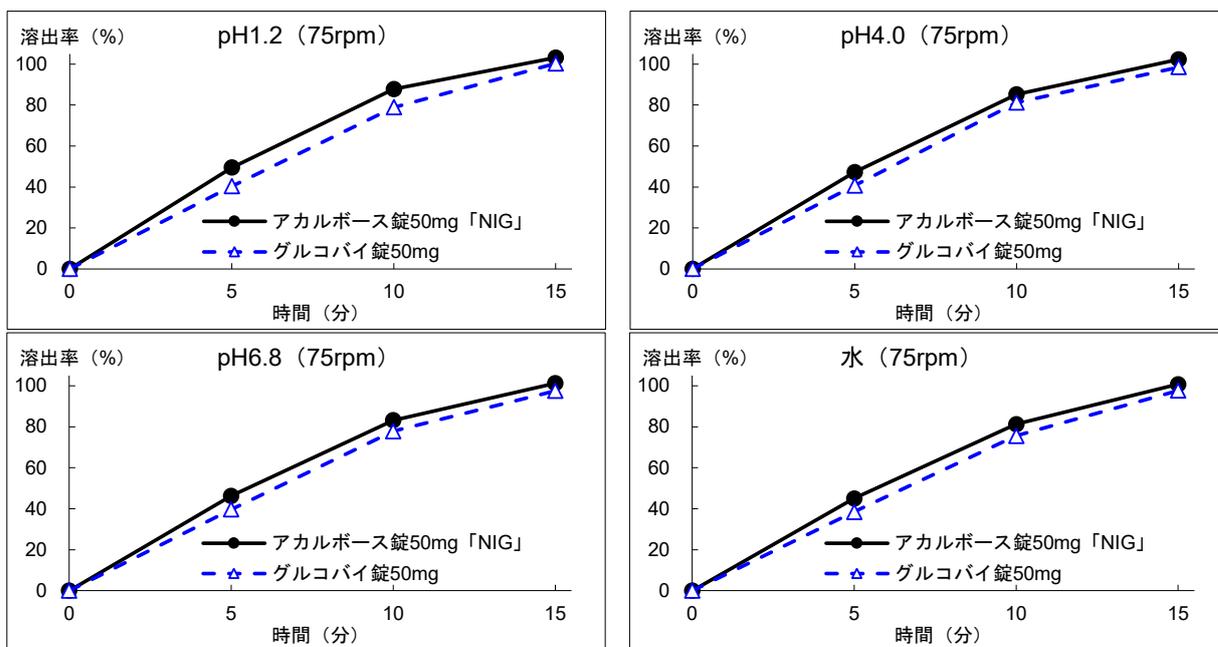
回転数及び試験液：75rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)

[判定]

- ・ pH1.2 (75rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH4.0 (75rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH6.8 (75rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ 水 (75rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤(グルコバイ錠 50mg)と比較した結果、全ての試験液において「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。

(溶出曲線)



## 〈アカルボース錠 100mg 「NIG」〉

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13年5月31日 医薬審発第786号)

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

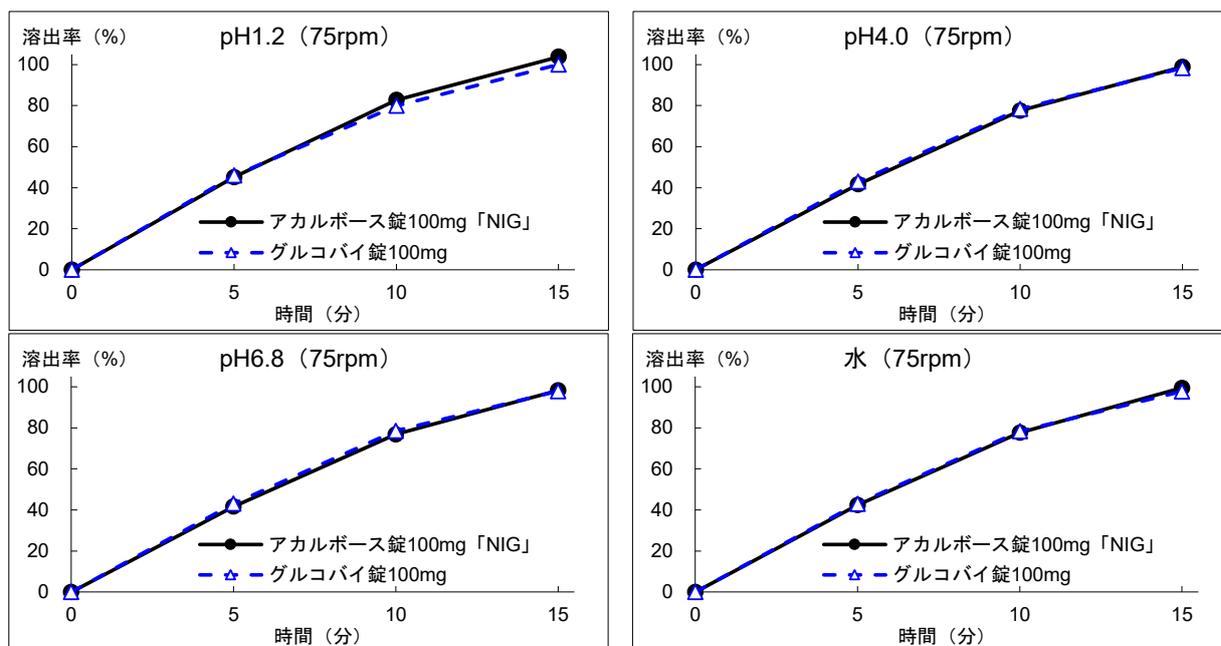
回転数及び試験液：75rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)

[判定]

- ・ pH1.2 (75rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH4.0 (7rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH6.8 (75rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ 水 (75rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤(グルコバイ錠 100mg)と比較した結果、全ての試験液において「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。

(溶出曲線)



## 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

#### 〈アカルボース錠 50mg 「NIG」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]、500錠 [10錠 (PTP) ×50]

#### 〈アカルボース錠 100mg 「NIG」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]、500錠 [10錠 (PTP) ×50]

### (3) 予備容量

該当しない

#### (4) 容器の材質

PTP : ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

ピロー : アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

#### 11. 別途提供される資材類

ブドウ糖

- ・ブドウ糖は日医工の $\alpha$ -GI阻害剤の採用実績に応じてのご提供となる。
- ・固形タイプ : ブドウ糖として 150g (2.7g 〈ブドウ糖として 2.5g〉 × 2 粒 / 包 × 2 包 15 連) / 箱
- ・粉末タイプ : 40g (10g × 4 包) / 箱

#### 12. その他

該当記載事項なし

## 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. 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

**5.1** 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。

**5.2** 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。

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

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。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 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）から投与を開始すること。  
[9.8 参照]

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

##### 17.1.1 単独療法（国内プラセボ対照二重盲検比較試験）

①インスリン非依存型糖尿病（NIDDM）患者を対象として、アカルボース 1 回 100mg 又はプラセボを 1 日 3 回 8 週間投与した。有用度は、有用以上がアカルボース群 33/85 例（38.8%）、プラセボ群 12/87 例（13.8%）であり、アカルボースの有用性が認められた（ $p < 0.001$ ）<sup>3)</sup>。

②NIDDM 患者を対象として、アカルボース 1 回 100mg 又はプラセボを 1 日 3 回 24～28 週間投与した。有用度は、有用以上がアカルボース群 10/17 例（58.8%）、プラセボ群 3/15 例（20.0%）であり、アカルボースの有用性が認められた（ $p < 0.05$ ）<sup>4)</sup>。

### 17.1.2 併用療法（国内一般臨床試験）

#### ①SU 剤との併用試験

- ・ NIDDM 患者を対象として、アカルボース 1 回 50mg~100mg を 1 日 3 回 12 週間投与した。12 週間後における食後血糖改善度は中等度改善以上が 18/55（32.7%）であった。副作用は 70 例中 14 例（20.0%）に 21 件認められ、放屁の増加 11 件、腹部膨満感 9 件、下痢 1 件であった<sup>5)</sup>。
- ・ NIDDM 患者を対象として、アカルボース 1 回 50mg~100mg を 1 日 3 回 12 週間投与した。12 週間後における食後血糖改善度は中等度改善以上が 40/103 例（38.8%）であった。副作用は 122 例中 25 例（20.5%）に 45 件認められ、主な副作用は放屁の増加 19 件、腹部膨満感 14 件、軟便 2 件等であった<sup>6)</sup>。

#### ②SU 剤との併用試験（国内長期投与試験）

NIDDM 患者を対象として、アカルボース 1 回 50mg~100mg を 1 日 3 回 28 週間以上投与<sup>\*</sup>した。治療期終了時における食後血糖改善度は中等度改善以上が 30/80 例（37.5%）であった。投与期間 6 ヶ月以上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た。副作用は 86 例中 16 例（18.6%）に 27 件認められ、主な副作用は放屁の増加 13 件、腹部膨満感 6 件等であった<sup>7)</sup>。

#### ③インスリン製剤との併用試験

インスリン製剤投与中の NIDDM 患者及びインスリン依存型糖尿病（IDDM）患者を対象として、アカルボース 1 回 50mg~100mg を 1 日 3 回 12 週間投与した。12 週間後における食後血糖改善度は、中等度改善以上が 39/81 例（48.1%）であった。副作用は 114 例中 21 例（18.4%）に 34 件認められ、主な副作用は放屁の増加 12 件、腹部膨満感 11 件等であった<sup>8)</sup>。

#### ④インスリン製剤との併用試験（国内長期投与試験）

インスリン製剤投与中の NIDDM 患者及び IDDM 患者を対象として、アカルボース 1 回 50mg~100mg を 1 日 3 回 28 週間以上投与<sup>\*</sup>した。治療期終了時における食後血糖改善度は、中等度改善以上が 19/37 例（51.4%）であった。投与期間 6 ヶ月以上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た。副作用は 52 例中 11 例（21.2%）に 19 件認められ、主な副作用は放屁の増加 5 件、腹部膨満感 5 件等であった<sup>9)</sup>。

※12 週間投与試験の終了時の用法・用量をそのまま継続した。忍容性を考慮して、300mg/日から減量が必要と判断した場合には 150mg/日で継続投与した。

## 2) 安全性試験

該当資料なし

### (5) 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（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

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調査・試験の概要

該当しない

### (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

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、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<sup>10)・14)</sup>。

- ・炭水化物（デンプン、マルトース、スクロース等）の $\alpha$ -グルコシダーゼによる加水分解を阻害し、消化管でのグルコース、フルクトースへの分解を直接抑制することにより糖質の吸収を遅延させる。
- ・食後の過血糖を改善するとともに、血糖の日内変動幅を小さくし、良好な血糖コントロールが得られる。
- ・食後の血糖上昇を抑制するに伴い、インスリンの上昇も抑制するので高インスリン血症を招かない。またアカルボースによるインスリン分泌に対する直接作用がないので、膵 $\beta$ 細胞の負担を軽減する。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 血糖値に対する作用

**18.2.1** 健康成人 7 例に 50mg、100mg、200mg を食事とともに単回経口投与した場合<sup>注)</sup>、食後の血糖上昇、血清インスリン上昇は用量依存的に抑制される<sup>12)</sup>。

**18.2.2** NIDDM 患者 12 例に 100mg を 1 日 3 回、毎食事とともに 3 ヶ月間経口投与した場合、空腹時血糖は有意に低下する<sup>13)</sup>。

注) 本剤の承認用量は 1 回 100mg、1 日 3 回である。

##### 18.3 血糖日内変動に対する作用

NIDDM 患者 19 例に 50mg 又は 100mg を 1 日 3 回毎食事とともに 2 週間経口投与した場合、血糖日内変動曲線は下方移動し、血糖日内変動曲線下面積は用量依存的に低下する<sup>14)</sup>。

##### 18.4 グリコヘモグロビン (HbA1) に対する作用

NIDDM 患者 12 例に 100mg を 1 日 3 回、毎食事とともに 3 ヶ月間経口投与した場合、HbA1 は有意に低下する<sup>13)</sup>。

## 18.5 生物学的同等性試験

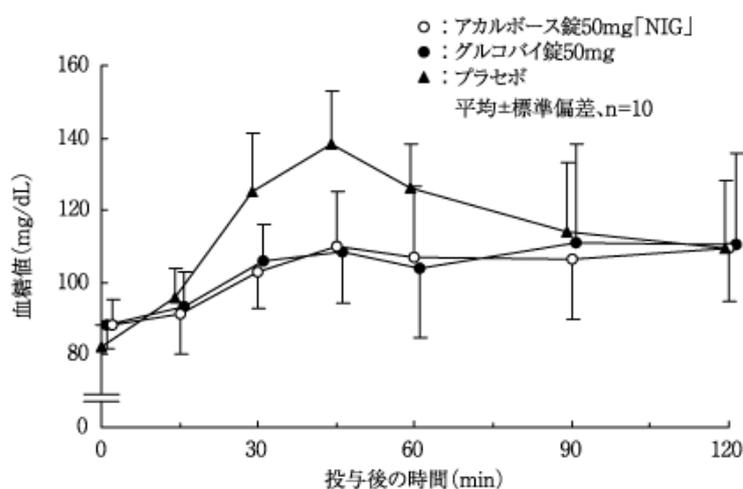
### 〈アカルボース錠 50mg 「NIG」〉

#### 18.5.1

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13年5月31日 医薬審第786号)

アカルボース錠 50mg 「NIG」とグルコバイ錠 50mg を、それぞれ1錠(アカルボースとして 50mg)健康成人男子に単回経口投与\*した時の血糖値は、いずれもプラセボ投与時に比して有意な上昇抑制を示した。得られたパラメータ(AUC)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<sup>15)</sup>。

\*投与直後に高炭水化物食を負荷した時の血糖値を測定した。



各製剤投与後の AUC<sub>0-120min</sub>

(単位: mg・min/dL)

アカルボース錠 50mg 「NIG」	グルコバイ錠 50mg	プラセボ	被験者数
12476±1628	12602±1824	13908±1195	n=10

(平均±標準偏差)

血糖値並びに AUC 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。

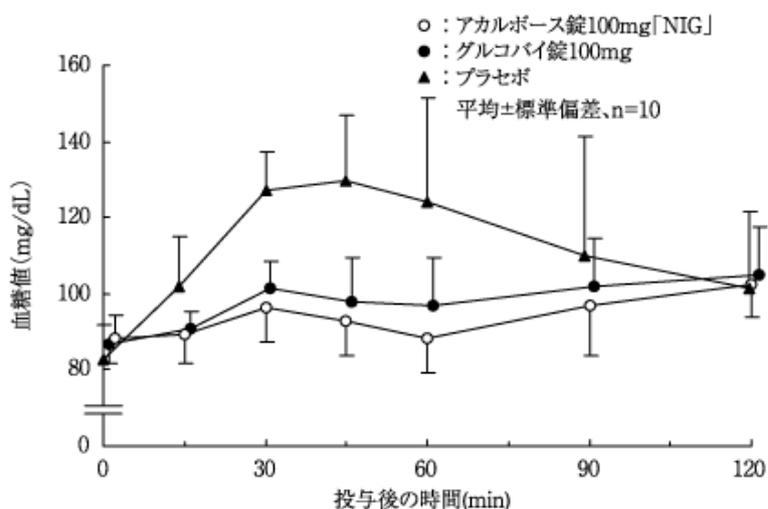
## 〈アカルボース錠 100mg 「NIG」〉

### 18.5.2

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 13 年 5 月 31 日 医薬審第 786 号）

アカルボース錠 100mg 「NIG」とグルコバイ錠 100mg を、それぞれ 1 錠（アカルボースとして 100mg）健康成人男子に単回経口投与<sup>※</sup>した時の血糖値は、いずれもプラセボ投与時に比して有意な上昇抑制を示した。得られたパラメータ（AUC）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<sup>15)</sup>。

※投与直後に高炭水化物食を負荷した時の血糖値を測定した。



各製剤投与後の AUC<sub>0-120min</sub>

(単位：mg・min/dL)

アカルボース錠 100mg 「NIG」	グルコバイ錠 100mg	プラセボ	被験者数
11263±793	11805±998	13602±1927	n=10

(平均±標準偏差)

血糖値並びに AUC 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**

#### **(1) 治療上有効な血中濃度**

該当資料なし

#### **(2) 臨床試験で確認された血中濃度**

健康成人に 100mg を単回経口投与した場合、未変化体及び活性代謝物の血中濃度はほとんどの測定時点で検出限界（3ng/mL）以下である<sup>16)</sup>。

#### **(3) 中毒域**

該当資料なし

#### **(4) 食事・併用薬の影響**

（「VIII. 7. 相互作用」の項参照）

### **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**

該当資料なし

### **5. 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**

（「VIII. 6. (5) 妊婦」の項参照）

#### **(3) 乳汁への移行性**

（「VII. 5. (5) その他の組織への移行性」、「VIII. 6. (6) 授乳婦」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**

ラットに経口投与した試験では、腎、副腎、次いで肝で高く、その他の臓器、組織ではいずれも血漿とほぼ同程度又はそれ以下である。なお、授乳ラットに経口投与した試験では、乳汁中に高濃度に移行するのが認められた<sup>17)</sup>。

#### **(6) 血漿蛋白結合率**

該当資料なし

### **6. 代謝**

#### **(1) 代謝部位及び代謝経路**

該当資料なし

#### **(2) 代謝に關与する酵素 (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**

該当資料なし

### **7. 排泄**

健康成人に 300mg<sup>注)</sup> を経口投与した場合、未変化体及び活性代謝物の尿中への排泄は投与後 24 時間でほぼ完了しており、尿中排泄率は投与後 24 時間で 0.20%、72 時間では 0.21%である<sup>16)</sup>。

また、健康成人に [<sup>14</sup>C] アカルボース 200mg<sup>注)</sup> を経口投与した場合、投与後 96 時間以内に投与放射能の 35.4%が尿中に、51.3%が糞中に排泄される<sup>16)</sup> (外国人データ)。

注) 本剤の承認用量は 1 回 100mg、1 日 3 回である。

### **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

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。〕

2.2 重症感染症、手術前後、重篤な外傷のある患者〔インスリンによる血糖管理が望まれる。〕

2.3 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

2.4 妊婦又は妊娠している可能性のある女性〔9.5 参照〕

### 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

8.1 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。〔11.1.1 参照〕

8.2 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。〔11.1.2 参照〕

8.3 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ことが多いので、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。〔11.1.3 参照〕

8.4 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。

8.5 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。〔11.1.1 参照〕

（解説）

8.2 本剤の主な副作用である「腹部膨満・鼓腸」及び「放屁増加」等の症状は本剤の薬理作用である腸管内における糖質の消化・吸収遅延により、未消化の糖質が大腸に達し腸内細菌によって分解発酵された際に生じたガスに起因すると考えられる。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<sup>18)・20)</sup>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。

## 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、腸閉塞があらわれることがある。[8.2、11.1.2 参照]

##### 9.1.2 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。

##### 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。

### (2) 腎機能障害患者

#### 9.2 腎機能障害患者

##### 9.2.1 重篤な腎機能障害のある患者

クレアチニンクリアランス 25mL/min 未満の患者では血中活性物質（未変化体及び活性代謝物）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（外国人データ）。

### (3) 肝機能障害患者

#### 9.3 肝機能障害患者

##### 9.3.1 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。肝機能障害患者を対象とした臨床試験は実施していない。

### (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。[2.4 参照]

### (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。

### (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

経過を十分に観察しながら慎重に投与すること。[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
スルホニルウレア系薬剤 スルホンアミド系薬剤 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 速効型食後血糖降下剤 [11.1.1 参照]	低血糖があらわれることがある。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。	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こと。	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	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こと。	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

### 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で低血糖（0.1%～5%未満）があらわれることがある。また、他の糖尿病用薬を併用していない場合でも低血糖（0.1%未満）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。[8.1、8.5、10.2 参照]

#### 11.1.2 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（0.1%未満）があらわれることがあるので、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すること。[8.2、9.1.1 参照]

#### 11.1.3 肝機能障害、黄疸

AST、ALTの上昇等を伴う重篤な肝機能障害、黄疸（0.1%未満）があらわれることがある。また、劇症肝炎（0.1%未満）の報告がある。[8.3 参照]

#### 11.1.4 重篤な肝硬変例での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、意識障害を伴うとの報告があるので、排便状況等を十分に観察すること。

## (2) その他の副作用

### 11.2 その他の副作用

	5%以上	5%未満	頻度不明
消化器	腹部膨満・鼓腸、放屁増加、軟便	排便回数増加、下痢、腹痛、便秘、嘔気、嘔吐、食欲不振、食欲亢進、消化不良	口渇、腸管のう腫状気腫症
過敏症		発疹、そう痒	
精神神経系		頭痛・頭重感、めまい、しびれ感	
肝臓		AST 上昇、ALT 上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、Al-P 上昇、LDH 上昇	
血液		白血球減少、血小板減少	貧血
その他		胸部圧迫感	浮腫、ほてり、味覚異常、頻尿

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

### 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。

## 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。

**14.1.2** 本剤は吸湿性が強いのでPTPシートの状態で保存するよう指導すること。[20. 参照]

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

#### 15.1 臨床使用に基づく情報

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（外国人データ）。

### (2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

## 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」の項参照)

#### (2) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (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

該当資料なし

#### (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

#### (3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

#### (4) がん原性試験

該当資料なし

#### (5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

#### (7) 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 「NIG」 アカルボース錠 100mg 「NIG」	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	アカルボース	なし

### 2. 有効期間

3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意点

#### 20.取扱い上の注意

吸湿性が強いので PTP シートの状態で保存すること。[14.1.2 参照]

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：有（「XⅢ. 2. その他の関連資料」の項参照）

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分：アカルボース錠 50mg/100mg 「サワイ」

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 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

#### 〈アカルボース錠 50mg 「NIG」〉

履歴	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
販売 開始	アカルボース錠 50mg「タイヨー」	2006年 3月15日	21800AMZ10224000	2007年 7月6日	2007年 7月6日
販売名 変更	アカルボース錠 50mg「テバ」	2014年 2月3日	22600AMX00149000	2016年 12月9日	2016年 12月9日
承継	アカルボース錠 50mg「NIG」	〃	〃	2022年 12月9日	2022年 12月9日

〈アカルボース錠 100mg 「NIG」〉

履歴	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
販売 開始	アカルボース錠 100mg「タイヨー」	2006年 3月15日	21800AMZ10225000	2007年 7月6日	2007年 7月6日
販売名 変更	アカルボース錠 100mg「テバ」	2013年 11月21日	22500AMX01872000	2016年 12月9日	2016年 12月9日
承継	アカルボース錠 100mg「NIG」	〃	〃	2022年 12月9日	2022年 12月9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

該当しない

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬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	個別医薬品コード (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
アカルボース錠 50mg 「NIG」	3969003F1018	3969003F1140	117849403	621784903
アカルボース錠 100mg 「NIG」	3969003F2014	3969003F2146	117850003	621785003

14. 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) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出試験
- 3) 五島雄一郎他：医学のあゆみ. 1989 ; 149 : 591-618
- 4) 坂本信夫他：臨床と研究. 1990 ; 67 : 219-233
- 5) 河盛隆造：薬理と治療. 1996 ; 24 : 837-852
- 6) 豊田隆謙他：薬理と治療. 1996 ; 24 : 639-657
- 7) 豊田隆謙他：薬理と治療. 1996 ; 24 : 1375-1392
- 8) 河盛隆造：薬理と治療. 1996 ; 24 : 853-872
- 9) 河盛隆造：薬理と治療. 1996 ; 24 : 1109-1129
- 10) Caspary WF, et al. : Res Exp Med (Berl). 1979 ; 175 : 1-6 (PMID : 441522)
- 11) 末広逸夫他：Clinica Chimica Acta. 1981 ; 117 : 145-152 (PMID : 6171367)
- 12) 三村悟郎他：医学と薬学. 1987 ; 18 : 1891-1898
- 13) 早川哲夫他：Nagoya J Med Sci. 1984 ; 47 : 35-41
- 14) 中埜幸治他：糖尿病. 1985 ; 28 : 701-706
- 15) 社内資料：生物学的同等性試験
- 16) 東純一他：医学と薬学. 1989 ; 22 : 365-381
- 17) Ahr HJ, et al. : Arzneimittel-Forsch/Drug Res. 1989 ; 39 : 1261-1267 (PMID : 2610718)
- 18) 後藤由夫他：薬理と治療. 1989 ; 17(8) : 387-401
- 19) 坂本信夫他：臨床と研究. 1990 ; 67(1) : 219-233
- 20) 傍島裕司他：プラクティス. 1995 ; 12(4) : 399-404

### **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

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

効能又は効果	用法及び用量
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）	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。

<DailyMed (USA)、2023年11月検索>

国名	米国
会社名	Aiping Pharmaceutical
販売名	ACARBOSE tablet
剤形・規格	25mg/50mg/100mg
<b>INDICATIONS AND USAGE</b>	
Acarbose Tablets are indicated as an adjunct to diet and exercise to improve glycemic control in adults with type 2 diabetes mellitus.	
<b>DOSAGE AND ADMINISTRATION</b>	
<p>There is no fixed dosage regimen for the management of diabetes mellitus with Acarbose Tablets or any other pharmacologic agent. Dosage of Acarbose Tablets must be individualized on the basis of both effectiveness and tolerance while not exceeding the maximum recommended dose of 100 mg t.i.d. Acarbose Tablets should be taken three times daily at the start (with the first bite) of each main meal. Acarbose Tablets should be started at a low dose, with gradual dose escalation as described below, both to reduce gastrointestinal side effects and to permit identification of the minimum dose required for adequate glycemic control of the patient. If the prescribed diet is not observed, the intestinal side effects may be intensified. If strongly distressing symptoms develop in spite of adherence to the diabetic diet prescribed, the doctor must be consulted and the dose temporarily or permanently reduced.</p> <p>During treatment initiation and dose titration, one-hour postprandial plasma glucose may be used to determine the therapeutic response to Acarbose Tablets and identify the minimum effective dose for the patient. Thereafter, glycosylated hemoglobin should be measured at intervals of approximately three months. The therapeutic goal should be to decrease both postprandial plasma glucose and glycosylated hemoglobin levels to normal or near normal by using the lowest effective dose of Acarbose Tablets, either as monotherapy or in combination with sulfonylureas, insulin or metformin.</p>	
<b>Initial Dosage:</b>	
The recommended starting dosage of Acarbose Tablets is 25 mg given orally three times daily at the start (with the first bite) of each main meal. However, some patients may benefit from more gradual dose titration to minimize gastrointestinal side effects. This may be achieved by initiating treatment at 25 mg once per day and subsequently increasing the frequency of administration to achieve 25 mg t.i.d.	
<b>Maintenance Dosage:</b>	
Once a 25 mg t.i.d. dosage regimen is reached, dosage of Acarbose Tablets should be adjusted at 4 to 8 week intervals based on one-hour postprandial glucose or glycosylated hemoglobin levels, and on tolerance. The dosage can be increased from 25 mg t.i.d. to 50 mg t.i.d. Some patients may benefit from further increasing the dosage to 100 mg t.i.d. The maintenance dose ranges from 50 mg t.i.d. to 100 mg t.i.d. However, since patients with low body weight may be at increased risk for elevated serum transaminases, only patients with body weight > 60 kg should be considered for dose titration above 50 mg t.i.d. If no further reduction in postprandial glucose or glycosylated hemoglobin levels is observed with titration to 100 mg t.i.d., consideration should be given to lowering the dose. Once an effective and tolerated dosage is established, it should be maintained.	
<b>Maximum Dosage:</b>	
The maximum recommended dose for patient's ≤ 60 kg is 50 mg t.i.d. The maximum recommended dose for patients > 60 kg is 100 mg t.i.d.	
<b>Patients Receiving Sulfonylureas or Insulin:</b>	
Sulfonylurea agents or insulin may cause hypoglycemia. Acarbose Tablets given in combination with a sulfonylurea or insulin will cause a further lowering of blood glucose and may increase the potential for hypoglycemia. If hypoglycemia occurs, appropriate adjustments in the dosage of these agents should be made.	

## 2. 海外における臨床支援情報

### 妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意の項の記載とオーストラリア分類とは異なる。

（「Ⅷ. 6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

	Drug Name	Category
オーストラリアの分類	acarbose	B3

(2021年4月検索)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類（An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）

Category 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

#### 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) 粉砕

##### 粉砕物の安定性試験

##### アカルボース錠 50mg 「NIG」

アカルボース錠 50mg 「NIG」の粉砕物安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は開始時には白色の粉末で、1 日後には白色の塊であった。

40℃、曝光下の保存条件において、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。

#### ● 粉砕物 40℃ [遮光・気密容器]

試験項目 <規格>	保存期間	
	開始時	4 週
性状 n=3	白色の粉末	白色の粉末
含量* (%) n=3 <95.0~105.0%>	100.24~101.40	98.69~99.88

※：表示量に対する含有率 (%)

#### ● 粉砕物 25℃・75%RH [散光・開放]

試験項目 <規格>	保存期間	
	開始時	1 日
性状 n=3	白色の粉末	白色の塊
含量* (%) n=3 <95.0~105.0%>	100.24~101.40	—

※：表示量に対する含有率 (%)      —：未実施

#### ● 粉砕物 25℃・曝光量 60 万 Lx・hr [散光・気密容器]

試験項目 <規格>	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx・hr
性状 n=3	白色の粉末	白色の粉末
含量* (%) n=3 <95.0~105.0%>	100.24~101.40	100.01~100.79

※：表示量に対する含有率 (%)

### アカルボース錠 100mg 「NIG」

アカルボース錠 100mg 「NIG」の粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は開始時には白色の粉末で、1 日後は白色の塊であった。

40℃、曝光下の保存条件において、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。

#### ● 粉砕物 40℃ [遮光・気密容器]

試験項目 <規格>	保存期間	
	開始時	4 週
性状 n=3	白色の粉末	白色の粉末
含量* (%) n=3 <95.0~105.0%>	100.19~100.94	99.76~100.69

※：表示量に対する含有率 (%)

#### ● 粉砕物 25℃・75%RH [散光・開放]

試験項目 <規格>	保存期間	
	開始時	1 日
性状 n=3	白色の粉末	白色の塊
含量* (%) n=3 <95.0~105.0%>	100.19~100.94	—

※：表示量に対する含有率 (%)      —：未実施

#### ● 粉砕物 25℃・曝光量 60 万 Lx・hr [散光・気密容器]

試験項目 <規格>	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx・hr
性状 n=3	白色の粉末	白色の粉末
含量* <sup>1</sup> (%) n=3 <95.0~105.0%>	100.19~100.94	100.05~101.00* <sup>2</sup>

※1：表示量に対する含有率 (%)      ※2：n=2

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

### アカルボース錠 50mg 「NIG」

#### 1. 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐときのチューブ内の残存物の有無にて通過性を観察した。

#### 2. 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
アカルボース錠 50mg 「NIG」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

### アカルボース錠 100mg 「NIG」

#### 1. 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐときのチューブ内の残存物の有無にて通過性を観察した。

#### 2. 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
アカルボース錠 100mg 「NIG」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分で崩壊せず、10 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

## 2. その他の関連資料

患者向け指導箋

日医工のアカルボース錠/OD錠を服用される方とご家族の方へ

### 日医工の アカルボース錠/OD錠 を服用される方とご家族の方へ

このお薬は、**食後の急激な血糖上昇を抑えるお薬**です。

#### 飲み方について

- このお薬は食事の直前に服用してください。もし、食事の直前に飲み忘れた時には食事中に服用してください。食後または空腹時の服用では、効果が弱くなります。
- 主治医または薬剤師の指示通りに服用してください。**  
自分の判断で服用を中止したり、服用する量をかえたりすると病気が悪化することがあります。
- OD錠は水なしでも服用することができます。舌の上でだ液を含ませ軽くつぶしてから、だ液と一緒に飲み込んでください。ただし、**水なしの場合には寝たまま服用しないでください。**