

## 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

## 糖尿病食後過血糖改善剤

アカルボース錠 50mg「サワイ」  
アカルボース錠 100mg「サワイ」

## ACARBOSE Tablets [SAWAI]

## アカルボース錠

剤形	錠50mg : 素錠 錠100mg : 割線入り素錠
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	錠50mg : 1錠中アカルボース50mg含有 錠100mg : 1錠中アカルボース100mg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 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日 : 2009年7月13日 薬価基準収載年月日 : 2009年11月13日 販売開始年月日 : 2009年11月13日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元 : 沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL : 0120-381-999、FAX : 06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト : <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2023年5月改訂の電子添文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—

### 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書(以下、添付文書)がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

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

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

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

### 2. IFとは

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

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には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。

(2020年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	23
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	23
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	23
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	23
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	23
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	5. 重要な基本的注意とその理由	23
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	24
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	25
1. 販売名	3	8. 副作用	26
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	26
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	26
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	27
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	27
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	IX. 非臨床試験に関する項目	28
III. 有効成分に関する項目	5	1. 薬理試験	28
1. 物理化学的性質	5	2. 毒性試験	28
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	29
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	1. 規制区分	29
IV. 製剤に関する項目	6	2. 有効期間	29
1. 剤形	6	3. 包装状態での貯法	29
2. 製剤の組成	7	4. 取扱い上の注意	29
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	5. 患者向け資材	29
4. 力価	7	6. 同一成分・同効薬	29
5. 混入する可能性のある夾雑物	7	7. 国際誕生年月日	29
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	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	29
7. 調製法及び溶解後の安定性	9	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	30
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	9	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	30
9. 溶出性	9	11. 再審査期間	30
10. 容器・包装	12	12. 投薬期間制限に関する情報	30
11. 別途提供される資材類	12	13. 各種コード	30
12. その他	13	14. 保険給付上の注意	30
V. 治療に関する項目	14	XI. 文献	31
1. 効能又は効果	14	1. 引用文献	31
2. 効能又は効果に関連する注意	14	2. その他の参考文献	31
3. 用法及び用量	14	XII. 参考資料	32
4. 用法及び用量に関連する注意	14	1. 主な外国での発売状況	32
5. 臨床成績	14	2. 海外における臨床支援情報	32
VI. 薬効薬理に関する項目	17	XIII. 備考	33
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	17	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	33
2. 薬理作用	17	2. その他の関連資料	34
VII. 薬物動態に関する項目	20		
1. 血中濃度の推移	20		
2. 薬物速度論的パラメータ	20		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	20		
4. 吸収	21		
5. 分布	21		
6. 代謝	21		
7. 排泄	22		
8. トランスポーターに関する情報	22		
9. 透析等による除去率	22		
10. 特定の背景を有する患者	22		
11. その他	22		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

アカルボース錠50mg/錠100mg「サワイ」は、アカルボースを含有する糖尿病食後過血糖改善剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第0331015号
承認	2009年7月
上市	2009年11月

### 2. 製品の治療学的特性

1) 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>1,2)</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。

(VI. -2. 参照)

2) 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。(VIII. -8. 参照)

3) 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. 参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

該当資料なし

### 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、最適使用ガイドライン等	有無
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

(2023年10月6日時点)

I. 概要に関する項目

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「サワイ」

アカルボース錠100mg「サワイ」

## 2) 洋名

ACARBOSE Tablets [SAWAI]

## 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

## 2. 一般名 .....

## 1) 和名(命名法)

アカルボース(JAN)

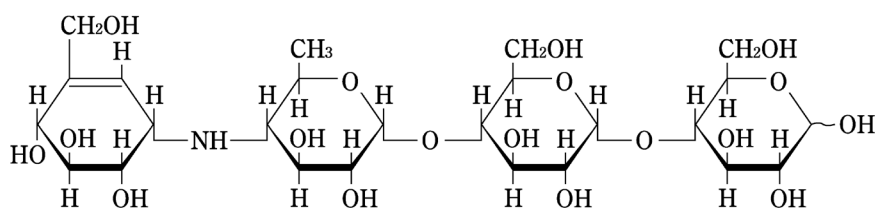
## 2) 洋名(命名法)

Acarbose(JAN)

## 3) ステム(stem)

不明

## 3. 構造式又は示性式 .....



## 4. 分子式及び分子量 .....

分子式 :  $C_{25}H_{43}NO_{18}$ 

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 $\rightarrow$ 4)-*O*- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-D-glucopyranose (IUPAC)

II. 名称に関する項目

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～淡黄色の粉末である。

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

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

水<sup>3)</sup> : 37°C、4時間は安定である。

液性(pH)<sup>3)</sup> : pH1.2、pH4.0及びpH6.8において、37°C、4時間は安定である。

光<sup>3)</sup> : 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、定量法

<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

<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

- アカルボース錠50mg「サワイ」：素錠
- アカルボース錠100mg「サワイ」：割線入り素錠

## 2) 製剤の外観及び性状

品名	アカルボース錠50mg「サワイ」	アカルボース錠100mg「サワイ」
外形		
性状	白色～淡黄色	
直径(mm)	7.0	9.0
厚さ(mm)	3.2	4.0
重量(mg)	約135	約270

## 3) 識別コード

## ●アカルボース錠50mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：SW AB50

## ●アカルボース錠100mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：SW AB100

## 4) 製剤の物性

## ●アカルボース錠50mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日本薬局方外医薬品規格第3部 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

## ●アカルボース錠100mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日本薬局方外医薬品規格第3部 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

## 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

品名	アカルボース錠50mg「サワイ」	アカルボース錠100mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	アカルボース	
	50mg	100mg
添加剤	カルメロースCa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、メタケイ酸アルミン酸Mg、リン酸水素Ca	

## 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

## ●アカルボース錠50mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>4)</sup>

アカルボース錠50mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色～淡黄色の素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
質量偏差試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験 <sup>※</sup>	103.6	101.6

※：表示量に対する含有率(%)

#### IV. 製剤に関する項目

##### 2) 無包装下の安定性<sup>5)</sup>

アカルボース錠50mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、温度及び光の条件下で性状変化、湿度及び室温の条件下で硬度低下が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3カ月)	湿度 (25°C75%RH 3カ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3カ月)
性状	白色の素錠	微黄色に変化 (規格内)	変化なし	微黄色に変化 (規格内)	変化なし
硬度(kg)	7.4	6.7	3.4	5.9	5.1
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 <sup>※</sup>	100.0	98.1	97.6	100.3	98.8

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

##### 3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験<sup>6)</sup>

アカルボース錠50mg「サワイ」のPTP包装品(ピロー包装なし)について、下記条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	室温(25°C60%RH 6カ月)
性状	白色の素錠	変化なし
硬度(kg)	7.4	6.0
純度試験	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験 <sup>※</sup>	100.0	101.2

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

#### ●アカルボース錠100mg「サワイ」

##### 1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>7)</sup>

アカルボース錠100mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6カ月
性状	白色～淡黄色の割線入り素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
質量偏差試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験 <sup>※</sup>	103.7	102.3

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性<sup>8)</sup>

アカルボース錠100mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、温度の条件下で性状変化、湿度の条件下で硬度低下及び含量低下、光の条件下で性状変化及び硬度低下、室温の条件下で硬度低下が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C 75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C 60%RH 3 ヶ月)
性状	白色の割線入り素錠	微黄色に変化(規格内)	変化なし	微黄色に変化(規格内)	変化なし
硬度(kg)	8.5	7.7	3.5	5.9	5.3
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.6	96.5	100.3	98.2

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※:イニシャルを100としたときの含有率(%)

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験<sup>9)</sup>

アカルボース錠50mg「サワイ」のPTP包装品(ピロー包装なし)について、下記条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	室温(25°C 60%RH 6 ヶ月)
性状	白色の素錠	変化なし
硬度(kg)	7.4	6.0
純度試験	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	101.2

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※:イニシャルを100としたときの含有率(%)

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当資料なし

## 9. 溶出性

<溶出挙動における同等性及び類似性>

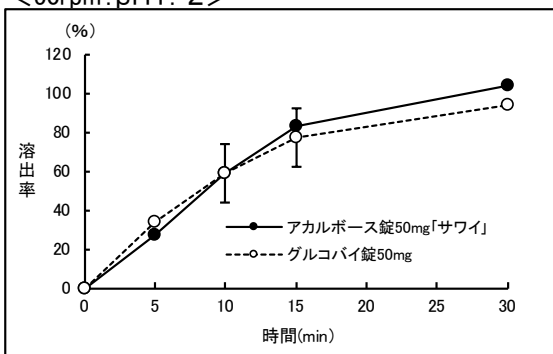
●アカルボース錠50mg「サワイ」<sup>10, 11)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」:平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、3.0、6.8、水)、100rpm(pH3.0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	アカルボース錠50mg「サワイ」	

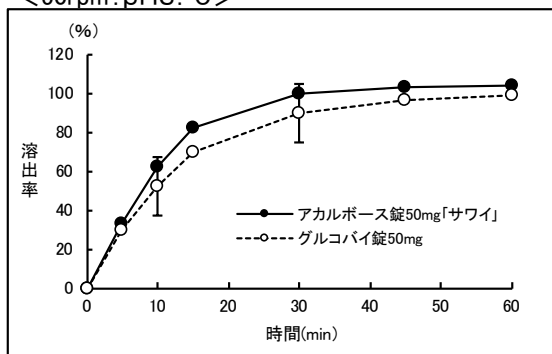
IV. 製剤に関する項目

標準製剤	グルコバイ錠 50mg
結果及び考察	<p>&lt;50rpm : pH1. 2&gt; 標準製剤の平均溶出率が 60% (10 分) 及び 85% (15 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH3. 0&gt; 標準製剤の平均溶出率が 60% (10 分) 及び 85% (30 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6. 8&gt; 標準製剤の平均溶出率が 60% (10 分) 及び 85% (30 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : 水&gt; 標準製剤の平均溶出率が 60% (10 分) 及び 85% (30 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm : pH3. 0&gt; 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>

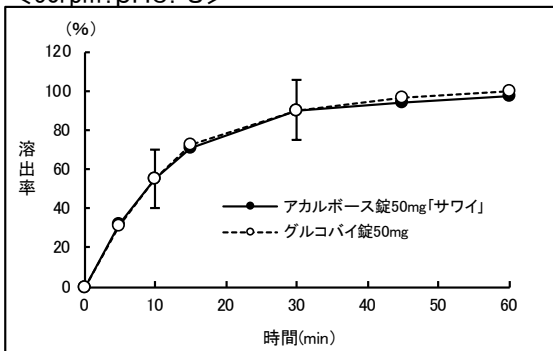
<50rpm : pH1. 2>



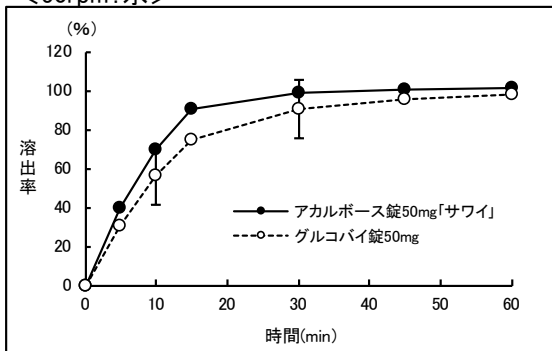
<50rpm : pH3. 0>



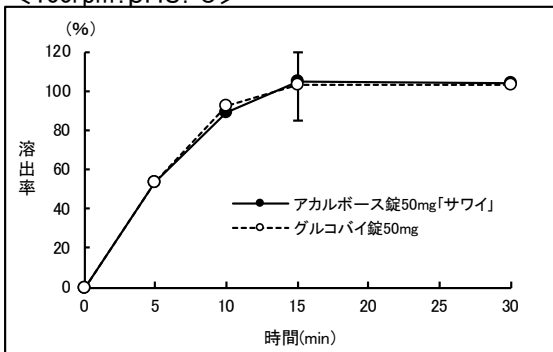
<50rpm : pH6. 8>



<50rpm : 水>



<100rpm : pH3. 0>

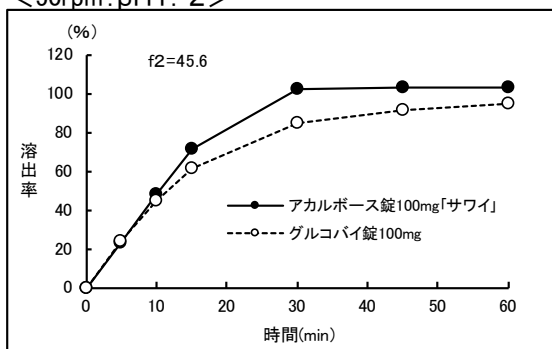


( [ ] : 判定基準の適合範囲)

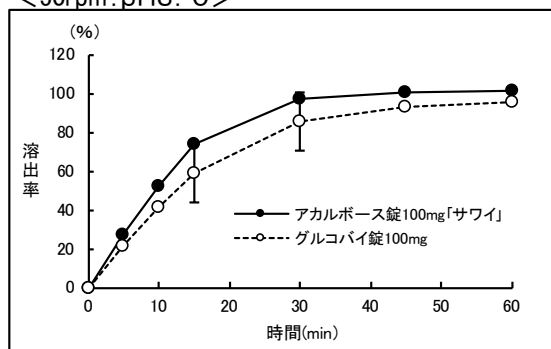
●アカルボース錠100mg「サワイ」<sup>10, 12)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、3.0、6.8、水)、100rpm(pH3.0)
試験回数	12 ベッセル	
試験製剤	アカルボース錠 100mg「サワイ」	
標準製剤	グルコバイ錠 100mg	
結果及び考察	<p>&lt;50rpm : pH1.2&gt; f2 関数の値が 42 以上であった。</p> <p>&lt;50rpm : pH3.0&gt; 標準製剤の平均溶出率が 60% (15 分) 及び 85% (30 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt; 標準製剤の平均溶出率が 40% (10 分) 及び 85% (30 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : 水&gt; 標準製剤の平均溶出率が 40% (10 分) 及び 85% (45 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm : pH3.0&gt; 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>	

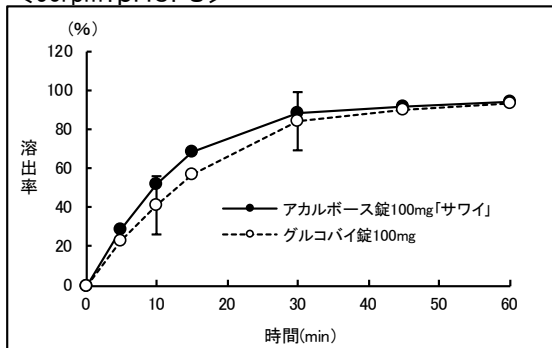
&lt;50rpm:pH1.2&gt;



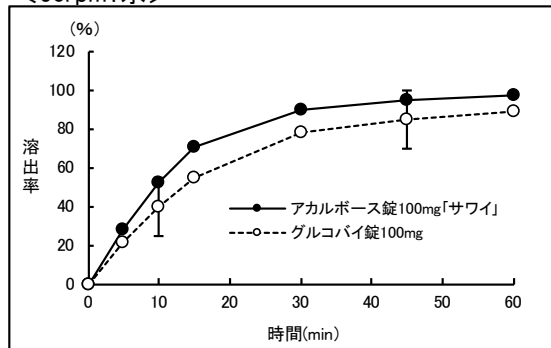
&lt;50rpm:pH3.0&gt;



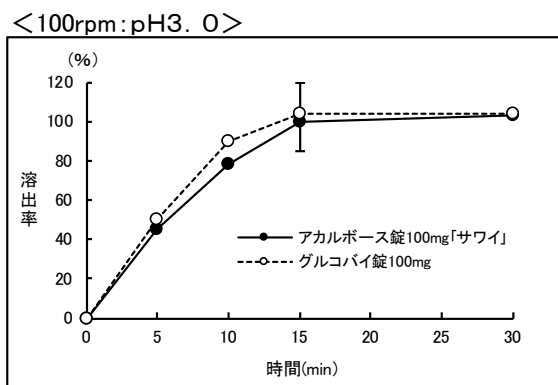
&lt;50rpm:pH6.8&gt;



&lt;50rpm:水&gt;



#### IV. 製剤に関する項目



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

#### 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

該当資料なし

##### 2) 包装

###### 22. 包装

〈アカルボース錠50mg「サワイ」〉

PTP[乾燥剤入り] : 100錠(10錠×10)

〈アカルボース錠100mg「サワイ」〉

PTP[乾燥剤入り] : 100錠(10錠×10)

##### 3) 予備容量

該当資料なし

##### 4) 容器の材質

###### ●アカルボース錠50mg「サワイ」

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

###### ●アカルボース錠100mg「サワイ」

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

#### 11. 別途提供される資材類

低血糖に備え、ブドウ糖を用意している。

粉タイプ : ブドウ糖として10g/1袋(約40kcal)

固形タイプ : ブドウ糖として5g/1袋(約20kcal)

注意 : ブドウ糖は医薬品ではありません。

請求法 : 沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 又は

沢井製薬株式会社「医薬品情報センター」 TEL : 0120-381-999



12. 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

4. 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

6. 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。

2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

設定されていない

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 有効性及び安全性に関する試験

## 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>13)</sup>。
- (2) 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>14)</sup>。

## 17.1.2 併用療法(国内一般臨床試験)

## (1) SU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>15)</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>16)</sup>。

## (2) SU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ヵ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>17)</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>18)</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ヵ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>19)</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

## V. 治療に関する項目

### 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

$\alpha$ -グルコシダーゼ (腸管での二糖類から単糖類への分解酵素) 阻害剤：アカルボース以外の化合物はない<sup>20)</sup>

### 2. 薬理作用

#### 1) 作用部位・作用機序

##### 18.1 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>1, 2)</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12例に50mg、100mg、200mgをスクロースとともに単回経口投与した場合<sup>注)</sup>、負荷後の血糖上昇、血清インスリン上昇は用量依存的に抑制される<sup>21)</sup>。

18.2.2 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>22)</sup>。

18.2.3 NIDDM患者12例に100mgを1日3回、毎食事とともに3ヵ月間経口投与した場合、空腹時血糖は有意に低下する<sup>23)</sup>。

##### 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>24)</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ヵ月間経口投与した場合、HbA1は有意に低下する<sup>23)</sup>。

注) 本剤の承認用量は1回100mg、1日3回である。

VI. 薬効薬理に関する項目

<薬力学的同等性試験>

●アカルボース錠50mg「サワイ」<sup>10, 25)</sup>

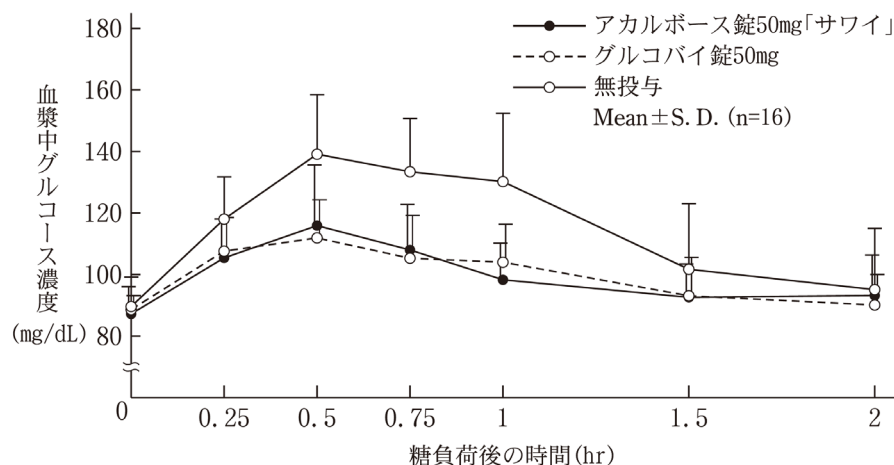
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
採血時点	0、0.25、0.5、0.75、1、1.5、2 hr
休薬期間	7日間
測定方法	ムタロターゼ法
試験製剤	アカルボース錠50mg「サワイ」
標準製剤	グルコバイ錠50mg

アカルボース錠50mg「サワイ」とグルコバイ錠50mgを健康成人男子にそれぞれ2錠(アカルボースとして100mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)した。無投与時及び投与直後にシヨ糖負荷(75g)し経時的に血漿中グルコース濃度を測定したところ、両剤は無投与時と比較して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<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

[AUC<sub>t</sub>: 血漿中グルコース濃度-時間曲線下面積、C<sub>max</sub>: 最高血漿中グルコース濃度]

	C <sub>max</sub> (mg/dL)	AUC <sub>t</sub> (mg·hr/dL)
アカルボース錠50mg「サワイ」	120.5 ± 15.0	199.7 ± 16.0
グルコバイ錠50mg	115.0 ± 11.1	200.4 ± 17.3
無投与	146.0 ± 15.9	232.2 ± 22.8

(Mean ± S.D.)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>t</sub>	log(1.00)	log(0.96) ~ log(1.04)
C <sub>max</sub>	log(1.05)	log(0.98) ~ log(1.11)

●アカルボース錠100mg「サワイ」<sup>10, 26)</sup>

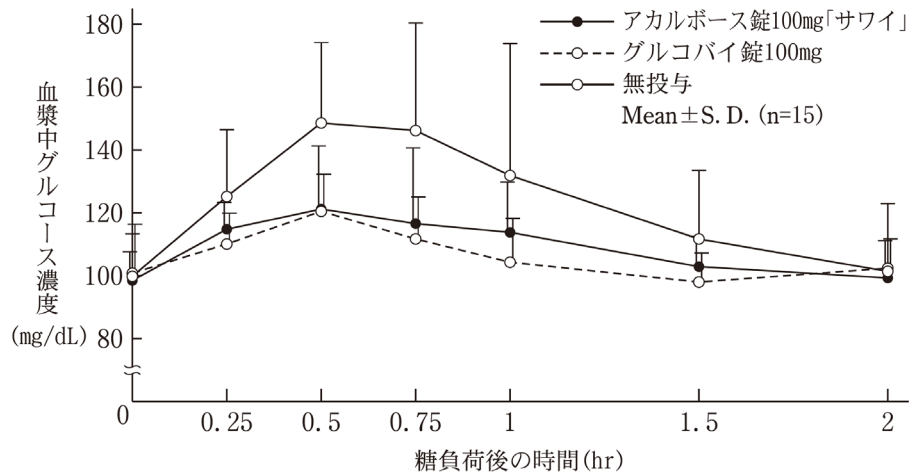
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
採血時点	0、0.25、0.5、0.75、1、1.5、2 hr
休薬期間	7日間
測定方法	ムタロターゼ法
試験製剤	アカルボース錠100mg「サワイ」
標準製剤	グルコバイ錠100mg

アカルボース錠100mg「サワイ」とグルコバイ錠100mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(アカルボースとして100mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)した。無投与時及び投与直後にショ糖負荷(75g)し経時的に血漿中グルコース濃度を測定したところ、両剤は無投与時と比較して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<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

[AUC<sub>t</sub> : 血漿中グルコース濃度-時間曲線下面積、C<sub>max</sub> : 最高血漿中グルコース濃度]

	C <sub>max</sub> (mg/dL)	AUC <sub>t</sub> (mg·hr/dL)
アカルボース錠100mg「サワイ」	129.0 ± 16.9	219.4 ± 20.0
グルコバイ錠100mg	122.6 ± 11.5	211.9 ± 17.1
無投与	159.6 ± 29.0	248.1 ± 40.5

(Mean ± S.D.)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>t</sub>	log(1.03)	log(1.00) ~ log(1.07)
C <sub>max</sub>	log(1.05)	log(0.98) ~ log(1.13)

血漿中グルコース濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>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

16.1 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(3 ng/mL)以下である<sup>27)</sup>。

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

VII. -7. 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) 参照

3) 乳汁への移行性

16.3 分布

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>28)</sup>。

VIII. -6. -6) 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

VII. -5. -3) 参照

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) 代謝に関する酵素(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

VII. 薬物動態に関する項目

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

16.5 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>27)</sup>。

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。]
- 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. 参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………  
V. -4. 参照

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。[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]

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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. 相互作用		
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場所に、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場所に、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 ラクチツール水和物	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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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、A1-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**  
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。

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」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

規制区分	
製剤	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	該当しない

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

### 2. 有効期間

有効期間：3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

#### 20. 取扱い上の注意

アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分：なし

同効薬： $\alpha$ -グルコシダーゼ(腸管での二糖類から単糖類への分解酵素)阻害剤

アカルボース以外の化合物はない<sup>20)</sup>

### 7. 国際誕生年月日

該当しない

### 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「サワイ」

製造販売承認年月日：2009年7月13日、承認番号：22100AMX01955000

薬価基準収載年月日：2009年11月13日

販売開始年月日：2009年11月13日

X. 管理的事項に関する項目

●アカルボース錠100mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2009年7月13日、承認番号：22100AMX01956000

薬価基準収載年月日：2009年11月13日

販売開始年月日：2009年11月13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(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

製品名	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「サワイ」	3969003F1093	3969003F1093	119587301	621958701
アカルボース錠 100mg「サワイ」	3969003F2090	3969003F2090	119588001	621958801

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。

---

## XI . 文 献

---

### 1. 引用文献

- 1) Caspary, W. F. et al. : Res. Exp. Med. (Berl), 1979 ; 175 : 1-6
- 2) 末広逸夫他 : Clinica Chimica Acta, 1981 ; 117 : 145-152
- 3) 日本公定書協会編, 医療用医薬品 品質情報集, No. 27, 薬事日報社, 2007, p. 167.
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] アカルボース錠50mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] アカルボース錠50mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] アカルボース錠50mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] アカルボース錠50mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] アカルボース錠100mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] アカルボース錠100mg「サワイ」
- 10) 陶易王他 : 診療と新薬, 2009 ; 46(9) : 864-872
- 11) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] アカルボース錠50mg「サワイ」
- 12) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] アカルボース錠100mg「サワイ」
- 13) 五島雄一郎他 : 医学のあゆみ, 1989 ; 149 : 591-618
- 14) 坂本信夫他 : 臨床と研究, 1990 ; 67 : 219-233
- 15) 河盛隆造 : 薬理と治療, 1996 ; 24 : 837-852
- 16) 豊田隆謙他 : 薬理と治療, 1996 ; 24 : 639-657
- 17) 豊田隆謙他 : 薬理と治療, 1996 ; 24 : 1375-1392
- 18) 河盛隆造 : 薬理と治療, 1996 ; 24 : 853-872
- 19) 河盛隆造 : 薬理と治療, 1996 ; 24 : 1109-1129
- 20) 薬剤分類情報閲覧システム <<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>  
(2023/10/11 アクセス)
- 21) Azuma, J. et al. : In Kuhlmann, J. Wingender, W. (eds.) Dose-Response Relationship of Drugs. W. Zuckschwerdt Verlag, 1990 ; 151-154
- 22) 三村悟郎他 : 医学と薬学, 1987 ; 18 : 1891-1898
- 23) 早川哲夫他 : Nagoya J. Med. Sci., 1984 ; 47 : 35-41
- 24) 中埜幸治他 : 糖尿病, 1985 ; 28 : 701-706
- 25) 沢井製薬(株) 社内資料[薬力学的試験] アカルボース錠50mg「サワイ」
- 26) 沢井製薬(株) 社内資料[薬力学的試験] アカルボース錠100mg「サワイ」
- 27) 東純一他 : 医学と薬学, 1989 ; 22 : 365-381
- 28) Ahr, H. J. et al. : Arzneim.-Forsch. /Drug Res., 1989 ; 39 : 1261-1267
- 29) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] アカルボース錠50mg「サワイ」
- 30) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] アカルボース錠100mg「サワイ」
- 31) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] アカルボース錠50mg「サワイ」
- 32) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] アカルボース錠100mg「サワイ」

### 2. その他の参考文献

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....
  
  2. 海外における臨床支援情報 .....
- 該当資料なし

## 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

##### 粉砕後の安定性試験

##### ●アカルボース錠50mg「サワイ」<sup>29)</sup>

アカルボース錠50mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験*	100.0	99.8	99.8	99.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

##### ●アカルボース錠100mg「サワイ」<sup>30)</sup>

アカルボース錠100mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験*	100.0	99.8	99.8	99.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## 2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

### 崩壊・懸濁性及びチューブ通過性試験

#### ●アカルボース錠50mg「サワイ」<sup>31)</sup>

##### 試験方法

1. アカルボース錠50mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

##### 結 果

懸濁状態	錠剤は完全には崩壊しなかった
チューブ通過性	—

##### 備考

上記の状態から更に5分間(合計15分間)放置したところ、錠剤は崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8Fr.チューブを通過した。

#### ●アカルボース錠100mg「サワイ」<sup>32)</sup>

##### 試験方法

1. アカルボース錠100mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

##### 結 果

懸濁状態	錠剤は完全には崩壊しなかった
チューブ通過性	—

##### 備考

上記の状態から更に5分間(合計15分間)放置したところ、錠剤は崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8Fr.チューブを通過した。

## 2. その他の関連資料.....

### 患者向け資料

- ・アカルボース錠「サワイ」を服用される方へ
- ・気をつけよう！血糖値と生活習慣
- ・糖尿病手帳
- ・自動車運転等は注意してください(お知らせ指導箋)

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照



