

| | |
|------|------------------------------|
| 貯法 | 室温保存 〔「取り扱い上の注意」 の項参照〕 |
| 使用期限 | 包装に表示の使用期 限内に使用すること。 |

食後過血糖改善剤

処方箋医薬品*

| | | |
|------|---------------|---------------|
| | 錠50mg | 錠100mg |
| 承認番号 | 22100AMX00218 | 22100AMX00213 |
| 薬価収載 | 2009年5月 | 2009年5月 |
| 販売開始 | 2009年5月 | 2009年5月 |

アカルボース錠50mg「YD」 アカルボース錠100mg「YD」

ACARBOSE TABLETS「YD」
アカルボース錠

*注意—医師等の処方箋により使用すること

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 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。〕
- 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。〕
- 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- 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〕







【組成・性状】

1. 組成

1錠中にそれぞれ次の成分を含有

| 販売名 | 有効成分 | 添加物 |
|------------------|--------------|---------------------------------|
| アカルボース錠50mg「YD」 | アカルボース 50mg | トウモロコシデンプン、セルロース、無水ケイ酸、ステアリン酸Mg |
| アカルボース錠100mg「YD」 | アカルボース 100mg | トウモロコシデンプン、セルロース、無水ケイ酸、ステアリン酸Mg |

2. 製剤の性状

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

【効能・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り)

【用法・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。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1)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のおそれがある。〕
- (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〕

2. 重要な基本的注意

- (1)他の糖尿病用薬と併用した場合に低血糖があらわれることがあるので、これらの薬剤との併用時には低用量から開始する、又は他の糖尿病用薬の用量を調整するなど慎重に投与すること。
- (2)患者に対し低血糖症状及びその対処方法について十分説明すること。
- (3)劇症肝炎等の重篤な肝機能障害があらわれることがある。これらは投与開始後概ね6ヵ月以内に認められる場合が多いので、投与開始後6ヵ月までは月1回、その後も定期的に肝機能検査を行うこと。
- (4)本剤の投与により、「腹部膨満・鼓腸」、「放屁増加」等の消化器系副作用が発現することがある。これらは、一般に時間の経過とともに消失することが多いが、症状に応じて減量あるいは消化管内ガス駆除剤の併用を考慮し、高度で耐えられない場合は投与を中止すること。
- (5)糖尿病の診断が確立した患者に対してのみ適用を考慮すること。
糖尿病以外にも耐糖能異常・尿糖陽性等、糖尿病類似の症状(腎性糖尿、老人性糖代謝異常、甲状腺機能異常等)を有する疾患があることに留意すること。
- (6)本剤の投与は、糖尿病治療の基本である食事療法・運動療法のみを行っている患者では投与の際、食後血糖2時間値が200mg/dL以上を示す場合に限り。
- (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。

3. 相互作用

併用注意（併用に注意すること）

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|--|--|---|
| スルホニルウレア系薬剤 グリベンクラミド グリクラジド 等 スルホンアミド系薬剤 グリブゾール ビグアナイド系薬剤 メトホルミン塩酸塩 ブホルミン塩酸塩 インスリン製剤 インスリン抵抗性改善剤 ピオグリタゾン塩酸塩 速効型食後血糖降下剤 ナテグリニド ミチグリニド | 低血糖があらわれることがあるので、このような症状が認められた場合にはショ糖ではなくブドウ糖を投与する。 | 左記糖尿病用薬の血糖降下作用に本剤の糖質吸収遅延作用が加わる。 |
| 上記糖尿病用薬とその血糖降下作用を増強する薬剤 β 遮断剤 サリチル酸剤 モノアミン酸化酵素阻害剤 等 | 糖尿病用薬の使用上の注意に記載の相互作用に留意するとともに、本剤の糖質吸収遅延作用が加わることによる影響に十分注意する。 | 左記薬剤により他の糖尿病用薬の血糖降下作用が増強されるところに、本剤の糖質吸収遅延作用が加わる。 |
| 上記糖尿病用薬とその血糖降下作用を減弱する薬剤 アドレナリン 副腎皮質ホルモン 甲状腺ホルモン 等 | 糖尿病用薬の使用上の注意に記載の相互作用に留意するとともに、本剤の糖質吸収遅延作用が加わることによる影響に十分注意する。 | 左記薬剤により他の糖尿病用薬の血糖降下作用が減弱されるところに、本剤の糖質吸収遅延作用が加わる。 |
| ジゴキシン | 本剤との併用によりジゴキシンの血中濃度が低下することがある。また、少数例で血中濃度の上昇も認められている。ジゴキシンの血中濃度が変動した場合には、ジゴキシンの投与量を調節するなど適切な処置を行う。 | 発現機序の詳細は不明である。 |
| ラクツロース ラクチトール水和物 | 消化器系の副作用が増強される可能性がある。 | 左記薬剤が、本剤の作用による未消化の他の二糖類とともに下部消化管へと移行し、腸内細菌によって分解を受けることから、併用により腸内ガス等が更に増加する可能性がある。 |

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|---------------------------|---------------------|---|
| 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。 |

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(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。

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

注) 投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者等忍容性の低下が懸念される患者に対しては低用量（1回50mg）から投与を開始し、経過を十分に観察しながら慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない（使用経験がない）。

** 8. 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。

9. 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。]

10. 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。

【薬物動態】

1. アカルボース錠50mg「YD」

溶出挙動

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

2. アカルボース錠100mg「YD」

溶出挙動

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

【薬効薬理】

1. アカルボース錠50mg「YD」

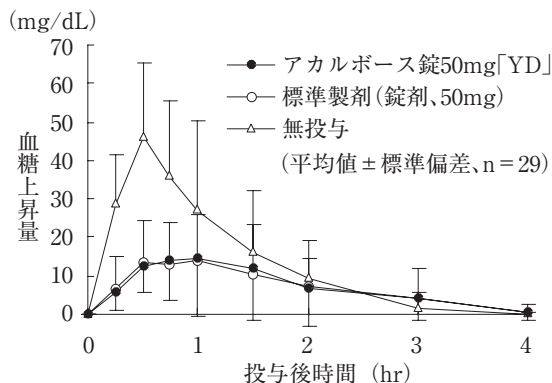
生物学的同等性試験

アカルボース錠50mg「YD」と標準製剤を健康成人男子29名にそれぞれ2錠（アカルボースとして100mg）、絶食単回経口投与し、無投与群を含む3群（クロスオーバー法）に対し、ショ糖負荷（100g）における血糖値の上昇量を経時的に測定した。その結果、無投与群に比較して両剤とも有意な血糖上昇抑制作用を示した。また、得られたパラメータ（AUC、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。¹⁾

[AUC:血糖上昇量-時間曲線下面積、Cmax:最高血糖上昇量]

| | 判定パラメータ | |
|-------------------|----------------------------------|-----------------|
| | AUC ₀₋₄ (mg·hr/dL) | Cmax (mg/dL) |
| アカルボース錠50mg「YD」 | 29.1±22.8 | 21.6±10.3 |
| 標準製剤 (錠剤、50mg) | 28.8±22.5 | 20.2±13.2 |

(平均値±標準偏差、n=29)



血糖上昇量並びに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。

2. アカルボース錠100mg「YD」

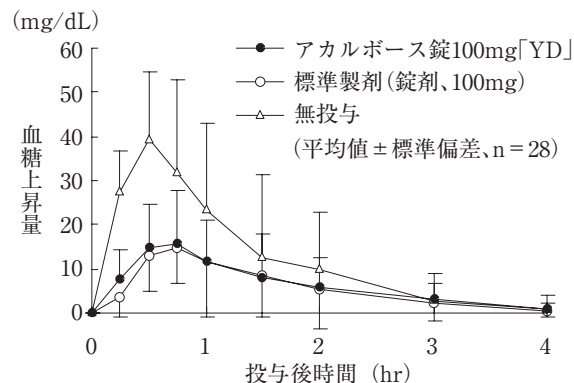
生物学的同等性試験

アカルボース錠100mg「YD」と標準製剤を健康成人男子28名にそれぞれ1錠（アカルボースとして100mg）、絶食単回経口投与し、無投与群を含む3群（クロスオーバー法）に対し、ショ糖負荷（100g）における血糖値の上昇量を経時的に測定した。その結果、無投与群に比較して両剤とも有意な血糖上昇抑制作用を示した。また、得られたパラメータ（AUC、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。²⁾

[AUC:血糖上昇量-時間曲線下面積、Cmax:最高血糖上昇量]

| | 判定パラメータ | |
|--------------------|----------------------------------|-----------------|
| | AUC ₀₋₄ (mg·hr/dL) | Cmax (mg/dL) |
| アカルボース錠100mg「YD」 | 25.6±22.1 | 19.7±10.7 |
| 標準製剤 (錠剤、100mg) | 22.9±17.8 | 18.6±8.4 |

(平均値±標準偏差、n=28)



血糖上昇量並びに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。

【有効成分に関する理化学的知見】

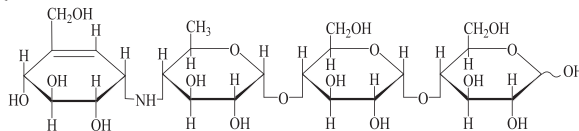
一般名：アカルボース (Acarbose)

化学名：O-4,6-Dideoxy-4-[[[(1S, 4R, 5S, 6S)-4, 5, 6-tri-hydroxy-3-(hydroxymethyl)-2-cyclohexene-1-yl]-amino]-α-D-glucopyranosyl-(1→4)-O-α-D-glucopyranosyl-(1→4)-D-glucopyranose

分子式：C₂₅H₄₃NO₁₈

分子量：645.60

構造式：



性状：白色～微黄白色の粉末である。

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。

吸湿性である。

【取り扱い上の注意】

1. アカルボース錠50mg「YD」

(1)保管方法

1) 使用期限内であっても、アルミピロー開封後はなるべく速やかに使用すること。

2) 本剤は吸湿性が強いので、アルミピロー開封後は湿気を避けて保存し、服用直前までPTPシートから取り出さないこと（一包化調剤は避けること）。

(2)注意

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

* (3)安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、アカルボース錠50mg「YD」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。³⁾

2. アカルボース錠100mg「YD」

(1)保管方法

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

(2)注意

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

* (3)安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、アカルボース錠100mg「YD」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。⁴⁾

【包装】

アカルボース錠50mg「YD」 (PTP) 100錠

アカルボース錠100mg「YD」 (PTP) 100錠

【主要文献】

- 1) 株陽進堂社内資料：アカルボース錠50mg「YD」の生物学的同等性試験
- 2) 株陽進堂社内資料：アカルボース錠100mg「YD」の生物学的同等性試験
- 3) 株陽進堂社内資料：アカルボース錠50mg「YD」の安定性試験
- 4) 株陽進堂社内資料：アカルボース錠100mg「YD」の安定性試験

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

第一三共エスファ株式会社 お客様相談室

〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3-5-1

TEL：0120-100-601

製造販売元



株式会社 陽進堂

富山県富山市婦中町萩島3697番地8号

販売元

第一三共エスファ株式会社

東京都中央区日本橋本町3-5-1

販売提携



Daiichi-Sankyo

第一三共株式会社

東京都中央区日本橋本町3-5-1