医療用医薬品最新品質情報（ブルーブック）（イメージ）

2016.〇.〇初版

有効成分	アカルボース	
品目（製造販売業者） 【後発医薬品】	1.　アカルボース錠５０ｍｇ「ＮＳ」（日新製薬（山形）） 2.　アカルボース錠５０ｍｇ「サワイ」（沢井製薬） 3.　アカルボース錠５０ｍｇ「ＪＧ」（日本ジェネリック） 4.　アカルボース錠５０ｍｇ「タイヨー」（テバ製薬） 5.　アカルボース錠５０ｍｇ「ＴＣＫ」（辰巳化学） 6.　アカルボース錠５０ｍｇ「日医工」（日医工） 7.　アカルボース錠５０ｍｇ「ＢＭＤ」（ビオメディクス） 8.　アカルボース錠５０ｍｇ「ファイザー」（ファイザー） 9.　アカルボース錠５０ｍｇ「ＹＤ」（陽進堂） 10.　アカルボース錠１００ｍｇ「ＮＳ」（日新製薬（山形）） 11.　アカルボース錠１００ｍｇ「サワイ」（沢井製薬） 12.　アカルボース錠１００ｍｇ「ＪＧ」（日本ジェネリック） 13.　アカルボース錠１００ｍｇ「タイヨー」（テバ製薬） 14.　アカルボース錠１００ｍｇ「ＴＣＫ」（辰巳化学） 15.　アカルボース錠１００ｍｇ「日医工」（日医工） 16.　アカルボース錠１００ｍｇ「ＢＭＤ」（ビオメディクス） 17.　アカルボース錠１００ｍｇ「ＹＤ」（陽進堂） 18.　アカルボース錠１００ｍｇ「ファイザー」（ファイザー） 19.　アカルボースＯＤ錠５０ｍｇ「タイヨー」（テバ製薬） 20.　アカルボースＯＤ錠５０ｍｇ「ファイザー」（ファイザー） 21.　アカルボースＯＤ錠１００ｍｇ「タイヨー」（テバ製薬） 22.　アカルボースＯＤ錠１００ｍｇ「ファイザー」（ファイザー）	
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①　グルコバイ錠５０ｍｇ（バイエル薬品） ②　グルコバイ錠１００ｍｇ（バイエル薬品） ③　グルコバイＯＤ錠５０ｍｇ（バイエル薬品） ④　グルコバイＯＤ錠１００ｍｇ（バイエル薬品）	
効能効果	http://・・・・・	
用法用量	http://・・・・・	
添加剤	http://・・・・・	
解離定数[1)]	p*K*a：5.1（滴定法）	
溶解度[1)]	（37℃）	pH1.2：10mg/mL 以上 pH4.0：10mg/mL 以上 pH6.8：10mg/mL 以上 水　　：10mg/mL 以上
安定性[1)]	水	37℃、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℃、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。

	その他	なし
膜透過性	なし	
BCS・Biowaiver option	なし	
薬効分類	396　糖尿病用剤	
規格単位	50mg1錠　100mg1錠	

【記載データ一覧】

	品目名	製造販売業者	ＢＥ	溶出	検査
1	アカルボース錠５０ｍｇ「ＮＳ」	日新製薬（山形）	○		
2	アカルボース錠５０ｍｇ「サワイ」	沢井製薬	○		
3	アカルボース錠５０ｍｇ「ＪＧ」	日本ジェネリック	○		
4	アカルボース錠５０ｍｇ「タイヨー」	テバ製薬	○		○
5	アカルボース錠５０ｍｇ「ＴＣＫ」	辰巳化学	○		
6	アカルボース錠５０ｍｇ「日医工」	日医工	○		
7	アカルボース錠５０ｍｇ「ＢＭＤ」	ビオメディクス	○		
8	アカルボース錠５０ｍｇ「ファイザー」	ファイザー	○		
9	アカルボース錠５０ｍｇ「ＹＤ」	陽進堂	○		
10	アカルボース錠１００ｍｇ「ＮＳ」	日新製薬（山形）	○	○※1	
11	アカルボース錠１００ｍｇ「サワイ」	沢井製薬	○	○※2	
12	アカルボース錠１００ｍｇ「ＪＧ」	日本ジェネリック	○	○※3	
13	アカルボース錠１００ｍｇ「タイヨー」	テバ製薬	○	○※4	○
14	アカルボース錠１００ｍｇ「ＴＣＫ」	辰巳化学	○		
15	アカルボース錠１００ｍｇ「日医工」	日医工	○	○※5	
16	アカルボース錠１００ｍｇ「ＢＭＤ」	ビオメディクス	○	○※6	
17	アカルボース錠１００ｍｇ「ファイザー」	ファイザー	○	○※7	
18	アカルボース錠１００ｍｇ「ＹＤ」	陽進堂	○	○※8	
19	アカルボースＯＤ錠５０ｍｇ「タイヨー」	テバ製薬	○		
20	アカルボースＯＤ錠５０ｍｇ「ファイザー」	ファイザー	○		
21	アカルボースＯＤ錠１００ｍｇ「タイヨー」	テバ製薬	○	○※9	
22	アカルボースＯＤ錠１００ｍｇ「ファイザー」	ファイザー	○	○※10	
23	グルコバイ錠５０ｍｇ	バイエル薬品	－		○
24	グルコバイ錠１００ｍｇ	バイエル薬品	－	○※11	○
25	グルコバイＯＤ錠５０ｍｇ	バイエル薬品	－		
26	グルコバイＯＤ錠１００ｍｇ	バイエル薬品	－	○※12	

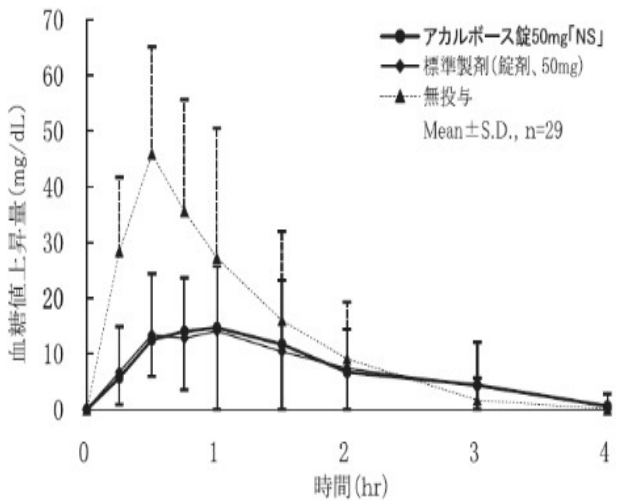
注）ＢＥ：生物学的同等性試験結果、溶出：溶出試験結果、検査：後発医薬品品質確保対策事業検査結果

注）陽進堂、日新製薬（山形）、日本ジェネリック、辰巳化学、ビオメディクスの製剤については、承認時において共同開発されたものである（審査管理課調査による）。

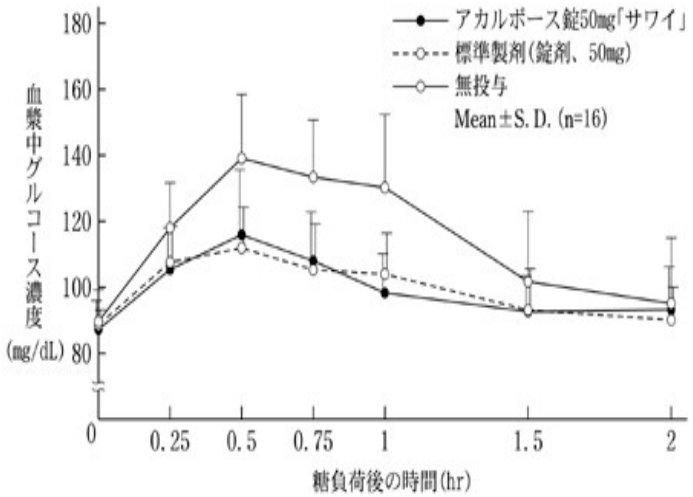
※１）①Ｎｏ．５
※２）①Ｎｏ．８
※３）①Ｎｏ．４
※４）①Ｎｏ．２
※５）①Ｎｏ．７
※６）①Ｎｏ．３
※７）①Ｎｏ．９
※８）①Ｎｏ．６
※９）②Ｎｏ．３
※10）②Ｎｏ．４
※11）①②Ｎｏ．１
※12）②Ｎｏ．２

【生物学的同等性試験結果】

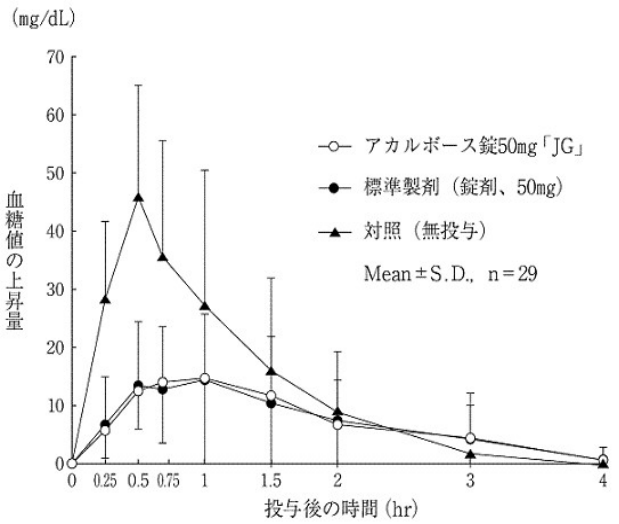
1



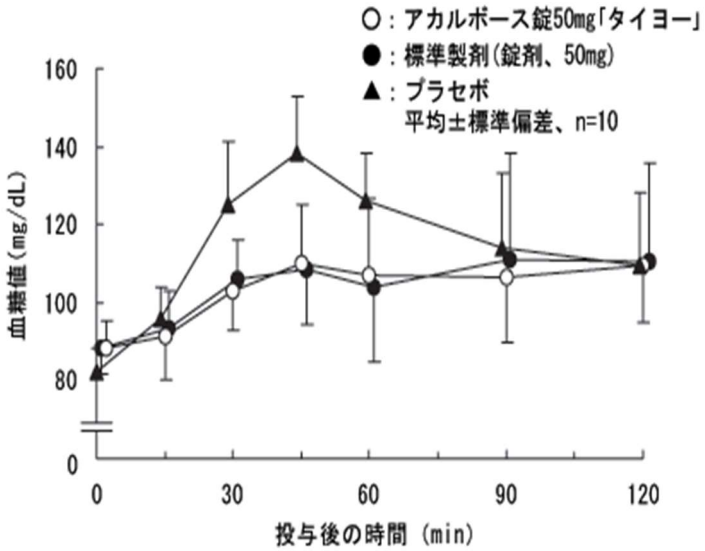
2



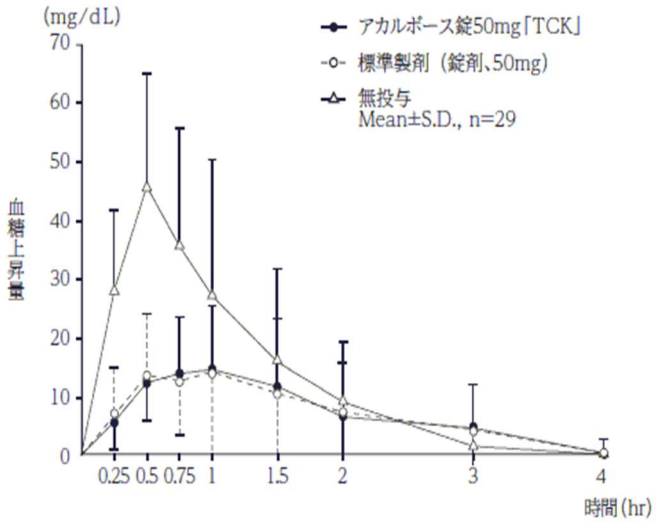
3



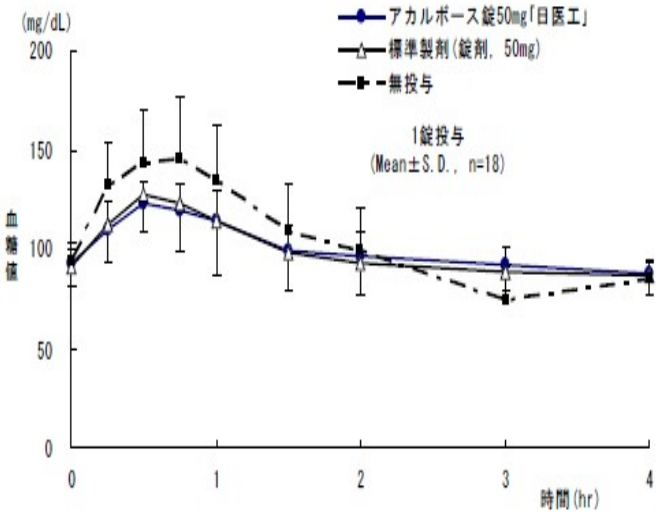
4



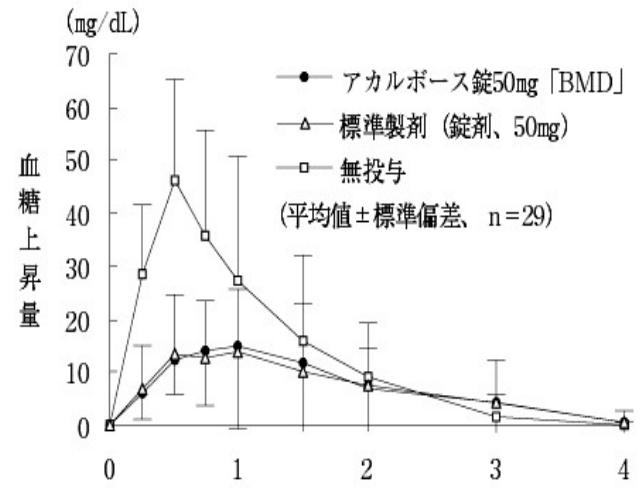
5



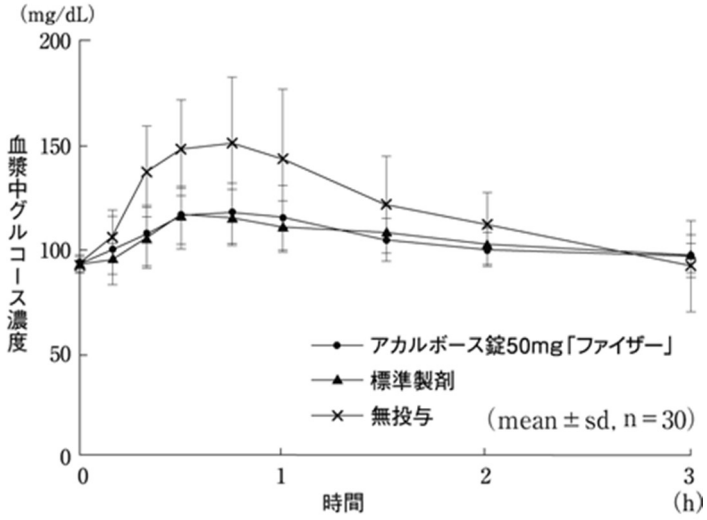
6



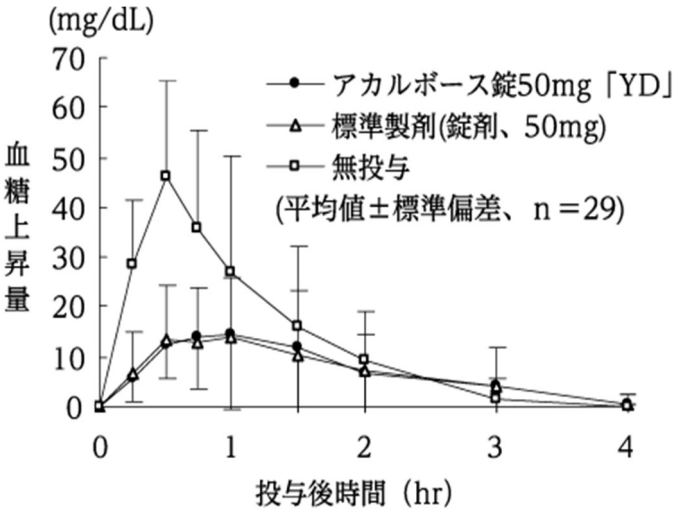
7


(mg/dL)
血糖上昇量
アカルボース錠50mg「BMD」
標準製剤（錠剤、50mg）
無投与
(平均値±標準偏差、n=29)

8


(mg/dL)
血漿中グルコース濃度
アカルボース錠50mg「ファイザー」
標準製剤
無投与
(mean ± sd, n=30)
時間
(h)

9

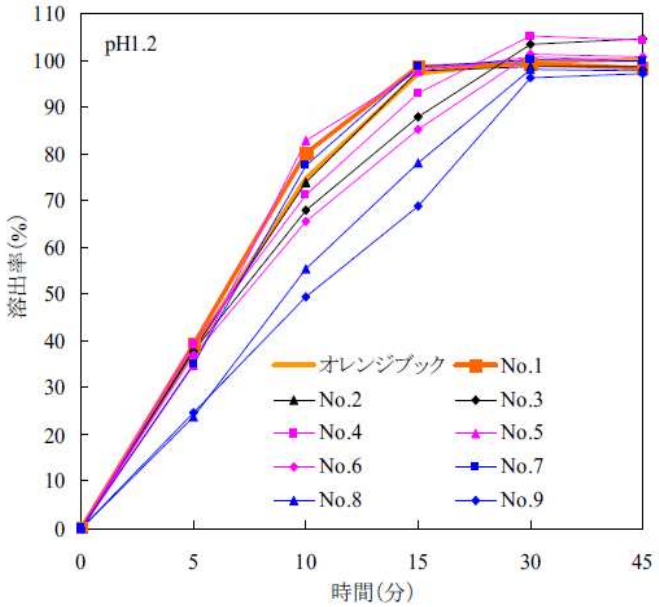

(mg/dL)
血糖上昇量
アカルボース錠50mg「YD」
標準製剤(錠剤、50mg)
無投与
(平均値±標準偏差、n=29)
投与後時間（hr）

（以下略）

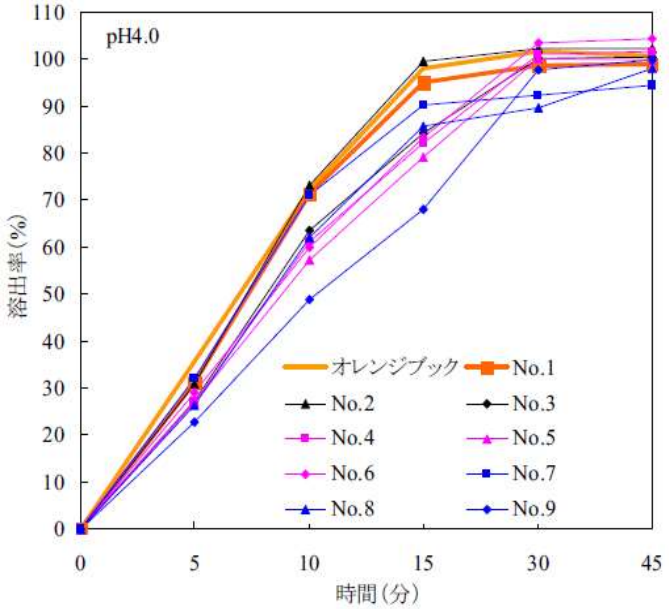
【溶出試験結果①】[2)]

製剤No	製品名	製造販売元	ロット番号	使用期限
No.1	グルコバイ錠100mg	バイエル薬品(株)	JPR2171	2014.04
No.2	アカルボース錠100mg「タイヨー」	大洋薬品工業(株)	AJ6095	2014.11
No.3	アカルボース錠100mg「BMD」	(株)ビオメディクス	1F1	2014.05
No.4	アカルボース錠100mg「JG」	日本ジェネリック(株)	9290	2013.08
No.5	アカルボース錠100mg「NS」	日新製薬(株)	701111	2014.01
No.6	アカルボース錠100mg「YD」	(株)陽進堂	YGC-2	2015.02
No.7	アカルボース錠100mg「日医工」	日医工(株)	JN1201	2014.01
No.8	アカルボース錠100mg「サワイ」	沢井製薬(株)	12101	2015.02
No.9	アカルボース錠100mg「マイラン」	マイラン製薬(株)	M012BU3	2015.03

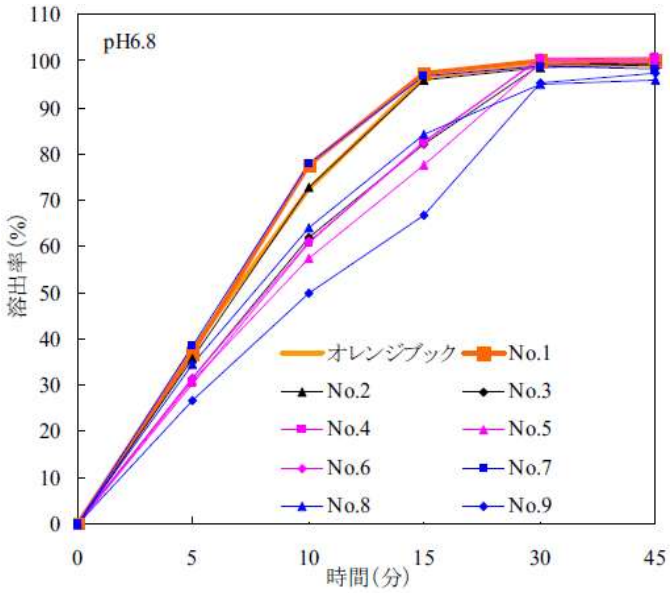
pH1.2



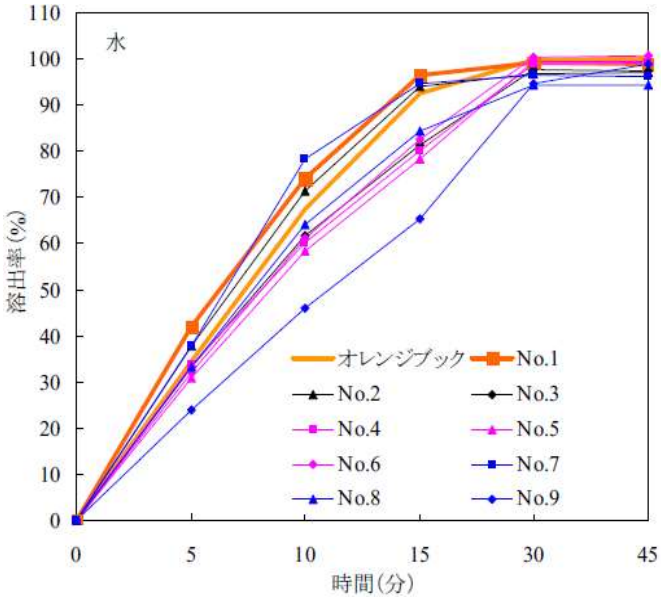
pH4.0



pH6.8



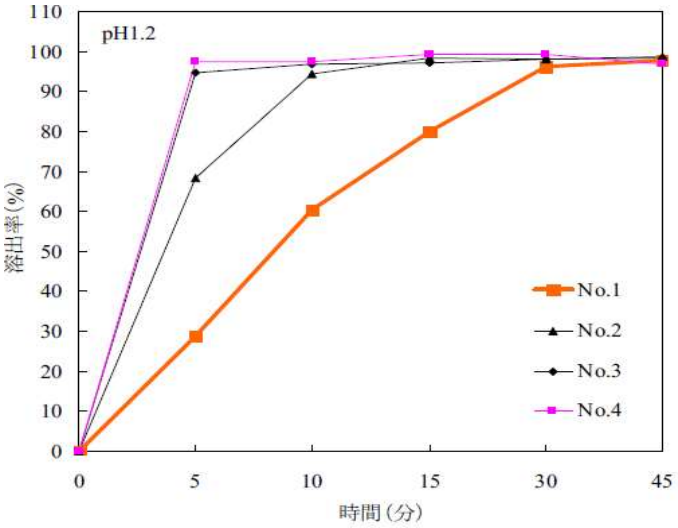
水



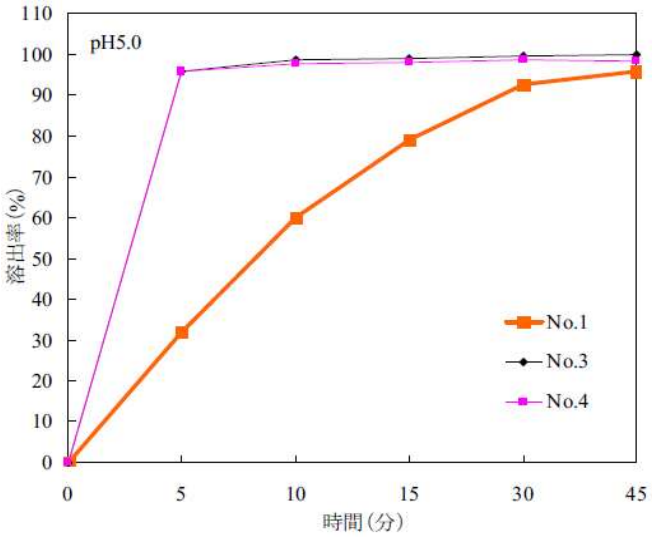
【溶出試験結果②】[2)]

製剤No	製品名	製造販売元	ロット番号	使用期限
No.1	グルコバイ錠100mg	バイエル薬品(株)	JPR2171	2014.04
No.2	グルコバイOD錠100mg	バイエル薬品(株)	JPR2310	2014.12
No.3	アカルボースOD錠100mg「タイヨー」	大洋薬品工業(株)	AR1361	2015.02
No.4	アカルボースOD錠100mg「マイラン」	マイラン製薬(株)	M013BU2	2014.02

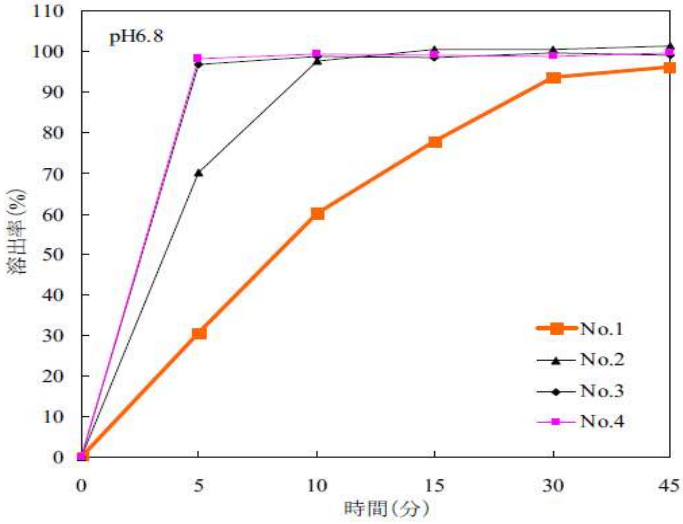
pH1.2



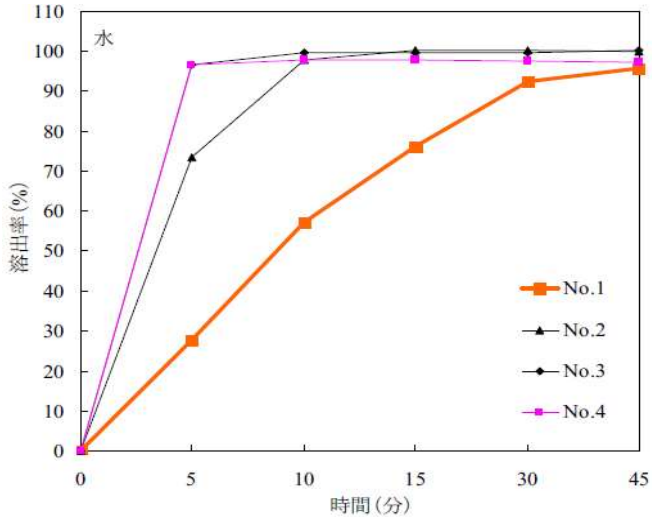
pH4.0



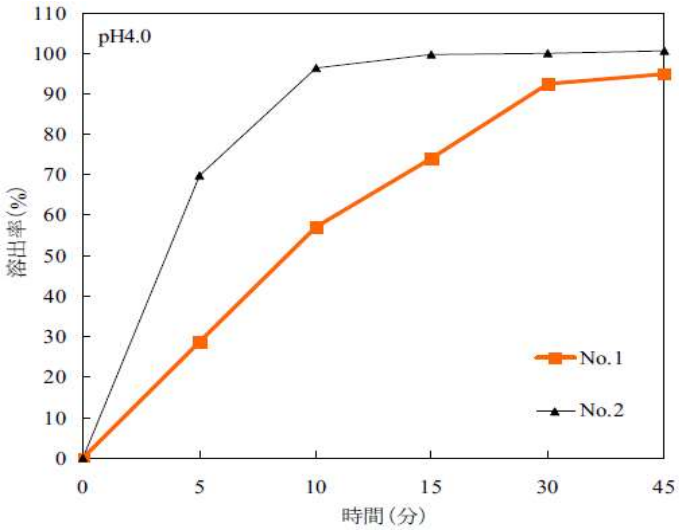
pH6.8



水



pH4.0



【後発医薬品品質確保対策事業検査結果】[3)]

平成２１年度　　適

【分析法】[4)]

アカルボース錠
Acarbose Tablet

溶出性〈6.10〉　本品1 個をとり，試験液に水900mL を用い，パドル法により，毎分75 回転で試験を行う．溶出試験を開始し，規定時間後，溶出液20mL 以上をとり，孔径0.45μm以下のメンブランフィルターでろ過する．初めのろ液10mL を除き，次のろ液 VmL を正確に量り，表示量に従い1mL 中にアカルボース($C_{25}H_{43}NO_{18}$)約56μg を含む液となるように水を加えて正確に V' mL とし，試料溶液とする．別にアカルボース標準品(別途0.3g につき，容量滴定法，直接滴定により水分〈2.48〉を測定しておく)約28mg を精密に量り，水に溶かし，正確に100mL とする．この液5mL を正確に量り，水を加えて正確に25mL とし，標準溶液とする．試料溶液及び標準溶液50μL ずつを正確にとり，次の条件で液体クロマトグラフィー〈2.01〉により試験を行い，それぞれの液のアカルボースのピーク面積 A_T 及び A_S を測定する．

本品が溶出規格を満たすときは適合とする．

アカルボース($C_{25}H_{43}NO_{18}$)の表示量に対する溶出率(%)

$$= W_S \times (A_T/A_S) \times (V'/V) \times (1/C) \times 180$$

W_S：脱水物に換算したアカルボース標準品の秤取量(mg)

C ：1 錠中のアカルボース($C_{25}H_{43}NO_{18}$)の表示量(mg)

試験条件

検出器：紫外吸光光度計(測定波長：210nm)

カラム：内径4.6mm，長さ15cm のステンレス管に5μm の液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする．

カラム温度：40℃付近の一定温度

移動相：リン酸二水素カリウム0.6g 及びリン酸水素二ナトリウム十二水和物0.70g を水1000mL に溶かし，0.5mol/L 水酸化ナトリウム試液を加え，pH6.7 に調整する．この液950mL に液体クロマトグラフィー用アセトニトリル50mL を加える．

流量：アカルボースの保持時間が約2 分になるように調整する．

システム適合性

システムの性能：標準溶液50μL につき，上記の条件で操作するとき，アカルボースのピークの理論段数及びシンメトリー係数は，それぞれ500 段以上，2.5 以下である．

システムの再現性：標準溶液50μL につき，上記の条件で試験を6 回繰り返すとき，アカルボースのピーク面積の相対標準偏差は2.0%以下である．

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

アカルボース標準品 $C_{25}H_{43}NO_{18}$：645.60　*O*-4,6-ジデオキシ-4-{[(1*S*, 4*R*, 5*S*, 6*S*)-4, 5,6-トリヒドロキシ-3-(ヒドロキシメチル)-2-シクロヘキセン-1-イル]アミノ}-α-D-グルコピラノシル-(1→4)-*O*-α-D-グルコピラノシル-(1→4)-D-グルコピラノースで下記の規格に適合するもの.

性状 本品は白色～淡黄色の粉末である.

確認試験 本品につき，赤外吸収スペクトル測定法〈2.25〉の臭化カリウム錠剤法により測定するとき，波数 3360cm^{-1}, 1654cm^{-1}, 1153cm^{-1} 及び 1033cm^{-1} 付近に吸収を認める.

類縁物質 本品 0.20g を水 10mL に溶かし，試料溶液とする．試料溶液 10μL につき，次の条件で液体クロマトグラフィー〈*2.01*〉により試験を行う．試料溶液のアカルボースのピーク面積 A 及び個々のピーク面積 An を自動積分法により測定し，次式により個々の類縁物質の量を求めるとき，類縁物質の合計は 3.0%以下である.

$$\text{個々の類縁物質の量(\%)} = \frac{A_n \times f_n}{A + \Sigma(A_n \times f_n)} \times 100$$

f_n：感度補正係数 次の感度補正係数を用いる.

アカルボースに対する相対保持時間	感度補正係数
約 0.54	0.75
約 0.82	0.625
約 1.61	1.25
約 1.82	1.25
約 2.06	1.25
その他	1.00

試験条件

検出器：紫外吸光光度計(測定波長：210 nm)

カラム：内径 4mm, 長さ 25cm のステンレス管に 5μm の液体クロマトグラフィー用アミノプロピルシリル化シリカゲルを充てんする.

カラム温度：35℃付近の一定温度

移動相：リン酸二水素カリウム 0.6g 及びリン酸水素二ナトリウム十二水和物 0.70g を水 1000mL に溶かし，0.5mol/L 水酸化ナトリウム試液を加え，pH6.7 に調整する．この液 280mL に液体クロマトグラフィー用アセトニトリル 720mL を加える.

流量：アカルボースの保持時間が約 15 分になるように調整する.

面積測定範囲：アカルボースの保持時間の約 2.5 倍の範囲

システム適合性

検出の確認：試料溶液 3mL を正確に量り，水を加えて正確に 100mL とし，システム適合性試験用溶液とする．システム適合性試験用溶液 5mL を正確に量り，水を加えて正確に 50mL とする．この液 10μL から得たアカルボースのピーク面積が，システム適合性試験用溶液のアカルボースのピーク面積の 7～13%になることを確認する.

システムの性能：試料溶液 10μL につき，上記の条件で操作するとき，アカルボースのピークの理論段数及びシンメトリー係数は，それぞれ 1700 段以上，2.0 以下である.

システムの再現性：システム適合性試験用溶液 10μL につき，上記の条件で試験を 6 回繰り返すとき，アカルボースのピーク面積の相対標準偏差は 2.0%以下である.

水分〈2.48〉 4.0%以下(0.3g, 容量滴定法, 直接滴定).
強熱残分〈2.44〉 0.5%以下(1.0g).
純度 本品を脱水物に換算したものの純度(%)＝100－類縁物質(%)－強熱残分(%)
本品を「アカルボース錠」の溶出試験（液体クロマトグラフィー）に用いる場合は，標準品の秤取量に純度(%)を乗ずる.

【関連情報】
特になし

【引用情報】
１）医療用医薬品品質情報集（厚生労働省医薬食品局審査管理課）（平成 19 年１月版）
２）第 11 回ジェネリック医薬品品質情報検討会　資料 11－1
３）平成 21 年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成 22 年８月、厚生労働省医薬食品局監視指導・麻薬対策課）
４）日本薬局方外医薬品規格第三部の一部改正について（平成 18 年 12 月 28 日付け薬食発第 1228001 号医薬食品局長通知）