

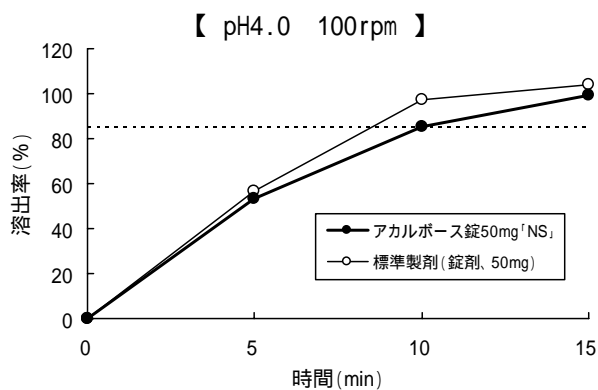
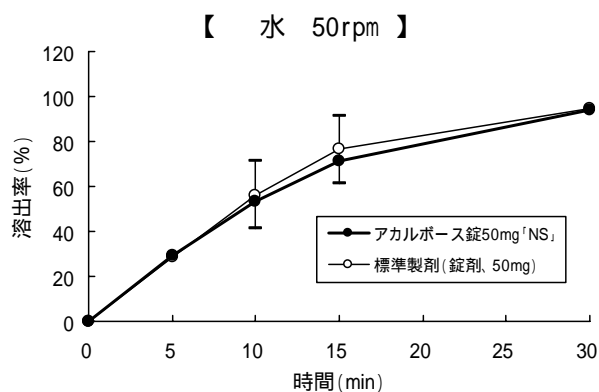
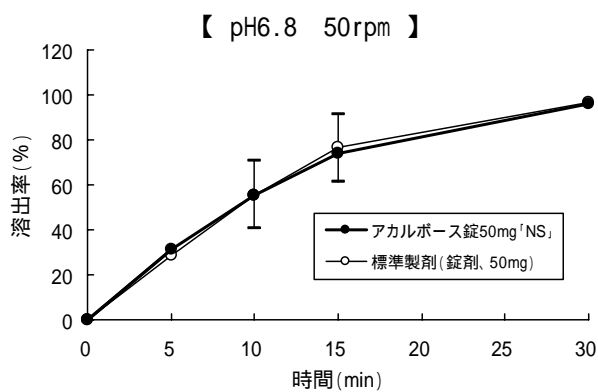
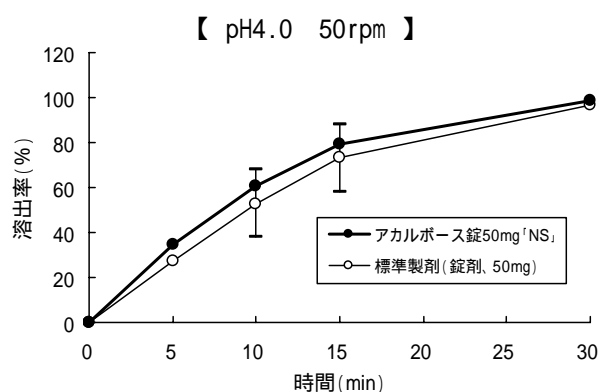
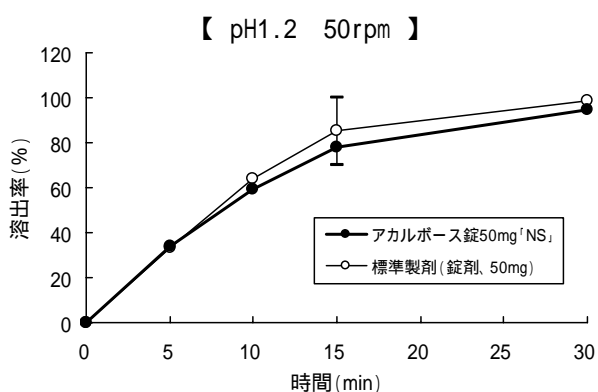
アカルボース錠 50mg 「NS」の溶出試験に関する資料

日新製薬株式会社
安全管理部


1. 溶出挙動の同等性

アカルボース錠 50mg 「NS」(日新製薬)及び標準製剤(錠剤、アカルボースとして 50mg)について、日本薬局方溶出試験第2法により、4種試験液(pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)、50rpm及びpH4.0、100rpmにおける溶出試験を実施した。

その結果、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 4.溶出挙動の同等性の判定」に従い判定するとき、両製剤の溶出挙動は同等であると判定された。



rpm	試験液	判定
50	pH1.2	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
	pH4.0	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
	pH6.8	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
	水	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
100	pH4.0	15分以内に平均85%以上溶出した。

判定ポイントにおける標準製剤の平均溶出率の±15%の範囲を  で示す。

(裏面へ続く)

2. 溶出試験

アカルボース錠 50mg「NS」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 50mg 錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

試験液：水

回転数：75rpm

規定時間：15分

	溶出率
溶出規格	85%以上
試験結果(%)	85~97

2012年1月改訂

アカルボース錠 50mg「NS」の生物学的同等性に関する資料

日新製薬株式会社
安全管理部

薬力学的試験による生物学的同等性試験

アカルボース錠 50mg「NS」(日新製薬)は、1錠中にアカルボース 50mg を含有する食後過血糖改善剤である。

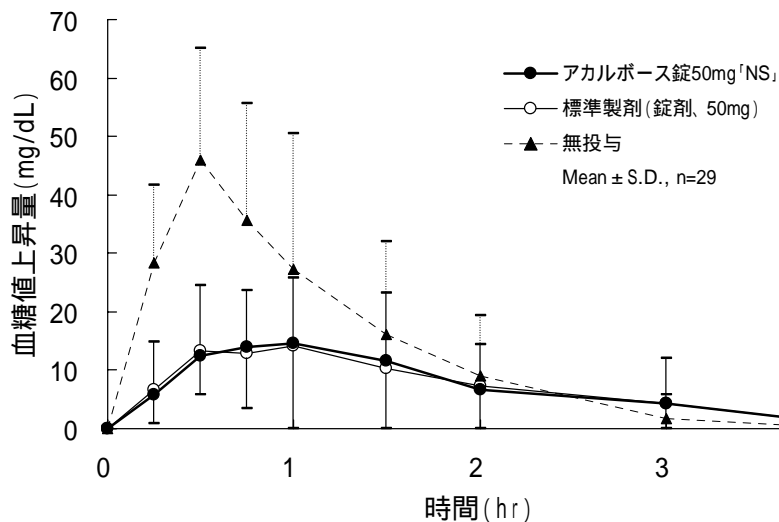
本剤の有効成分であるアカルボースは、吸収されて効果を発現するのではなく、唾液・膵液中の α -アミラーゼ及び小腸粘膜微絨毛膜に存在する α -グルコシダーゼ(グルコアミラーゼ、スクラーゼ、マルターゼ、イソマルターゼ)活性を阻害することにより、単糖類を除く各種糖質の消化・吸収を遅延させ食後血糖の上昇を抑制する。

そこで、アカルボース錠 50mg「NS」及び標準製剤(錠剤、アカルボースとして 50mg)について、シヨ糖負荷における血糖値上昇量を測定することにより、その薬理効果を指標として両製剤の生物学的同等性を検証した。

1. 血糖値上昇量比較試験

健康成人男子 29 名を 3 群に分け、7 日間の休薬期間をおいたクロスオーバー法で、血糖値上昇量を比較検討した。アカルボース錠 50mg「NS」又は標準製剤(錠剤、50mg)を、それぞれ 2 錠(アカルボースとして 100mg)絶食時単回経口投与し、その 10 分後にシヨ糖溶液(シヨ糖 100g を水 150mL に溶解させたもの)を経口投与した。1 群はシヨ糖負荷のみの無投与群とした。シヨ糖投与時を 0 時点とし、血糖値上昇量を測定した。なお、投与後 4 時間までは絶食とした。

その結果、血糖値上昇量の推移は以下に示したとおりであり、シヨ糖負荷のみの無投与群と比較して、両製剤とも同様の有意な血糖値上昇抑制作用を示した。また、統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。



	血糖値上昇量 (mg/dL)										AUC ₀₋₄ (mg·hr/dL)	Cmax (mg/dL)
	0 hr	0.25 hr	0.5 hr	0.75 hr	1 hr	1.5 hr	2 hr	3 hr	4 hr			
アカルボース錠50mg「NS」	0.0	5.7	12.5	14.0	14.7	11.7	6.7	4.4	0.6	29.1	21.6	
± S.D.	-	4.8	6.6	9.6	11.0	11.5	9.6	7.7	2.2	22.8	10.3	
標準製剤(錠剤、50mg)	0.0	6.7	13.4	12.8	14.1	10.4	7.4	4.2	0.7	28.8	20.2	
± S.D.	-	8.2	11.0	9.3	14.5	11.9	7.0	5.8	2.1	22.5	13.2	

(n=29)

(裏面へ続く)

2.まとめ

アカルボース錠 50mg「NS」と標準製剤（錠剤、50mg）は生物学的に同等であり、臨床の間においても同等の効果が期待できると判断した。

2011年1月改訂