

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2018. 2. 23 初版

有効成分	アルガトロバン水和物																												
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	アルガトロバン注射液 10mg 「サワイ」	沢井製薬																										
	2	アルガトロバン注射液 10mg 「日医工」	日医工																										
	3	アルガトロバン注射液 10mg 「SN」	シオノケミカル																										
	4	アルガトロバン注シリンジ 10mg 「NP」	ニプロ																										
	5	アルガトロバン注 10mg シリンジ 「SN」	シオノケミカル																										
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	スロンノンHI注 10mg / 2mL	第一三共																										
	②	ノバスタンHI注 10mg / 2mL	田辺三菱製薬																										
効能・効果	http://www.bbdb.jp																												
用法・用量	http://www.bbdb.jp																												
添加物	http://www.bbdb.jp																												
解離定数 ^{1)、2)}	pKa=0.5（カルボン酸）、11.0（グアニジノ基）																												
溶解度 ^{1)、2)}	水に極めて溶けにくい（溶質 1g を溶かすのに要する水の量；2,000mL）。																												
原薬の安定性 ¹⁾	水 ^{1)、2)}	<table border="1"> <thead> <tr> <th></th> <th>保存条件</th> <th>保存期間</th> <th>保存形態</th> <th>結果</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>苛酷試験</td> <td>水溶液 (0.05W/v%)</td> <td>40°C、水溶液</td> <td>30日</td> <td>褐色アンプルに封入</td> <td>変化なし</td> </tr> </tbody> </table>					保存条件	保存期間	保存形態	結果	苛酷試験	水溶液 (0.05W/v%)	40°C、水溶液	30日	褐色アンプルに封入	変化なし													
			保存条件	保存期間	保存形態	結果																							
苛酷試験	水溶液 (0.05W/v%)	40°C、水溶液	30日	褐色アンプルに封入	変化なし																								
液性 (pH) ^{1)、2)}	液性 (pH) ^{1)、2)}	<table border="1"> <thead> <tr> <th></th> <th>保存条件</th> <th>保存期間</th> <th>保存形態</th> <th>結果</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td rowspan="5">苛酷試験</td> <td rowspan="5">水溶液 (0.05W/v%)</td> <td>40°C、pH1 緩衝液に溶解</td> <td>3日</td> <td rowspan="5">褐色アンプルに封入</td> <td rowspan="5">2日目より黄変し、TLC、定量で1日目より分解物による変化が認められた。</td> </tr> <tr> <td>40°C、pH3 緩衝液に溶解</td> <td>3日</td> </tr> <tr> <td>40°C、pH5 緩衝液に溶解</td> <td>3日</td> </tr> <tr> <td>40°C、pH7 緩衝液に溶解</td> <td>3日</td> </tr> <tr> <td>40°C、pH9 緩衝液に溶解</td> <td>4日</td> </tr> <tr> <td></td> <td></td> <td></td> <td></td> <td>変化なし</td> </tr> </tbody> </table>					保存条件	保存期間	保存形態	結果	苛酷試験	水溶液 (0.05W/v%)	40°C、pH1 緩衝液に溶解	3日	褐色アンプルに封入	2日目より黄変し、TLC、定量で1日目より分解物による変化が認められた。	40°C、pH3 緩衝液に溶解	3日	40°C、pH5 緩衝液に溶解	3日	40°C、pH7 緩衝液に溶解	3日	40°C、pH9 緩衝液に溶解	4日					変化なし
			保存条件	保存期間	保存形態	結果																							
		苛酷試験	水溶液 (0.05W/v%)	40°C、pH1 緩衝液に溶解	3日	褐色アンプルに封入	2日目より黄変し、TLC、定量で1日目より分解物による変化が認められた。																						
				40°C、pH3 緩衝液に溶解	3日																								
				40°C、pH5 緩衝液に溶解	3日																								
				40°C、pH7 緩衝液に溶解	3日																								
40°C、pH9 緩衝液に溶解	4日																												
				変化なし																									

光

①¹⁾

		保存条件	保存期間	保存形態	結果
苛酷試験	粉末状態	室内散光 (500lx、1日12時間)	6ヵ月	無色瓶・密栓	ほとんど変化なし
		室内散光 (500lx、1日12時間)	6ヵ月	褐色瓶・開放	ほとんど変化なし
		UV照射 (20W、50cm、連続照射)	3日	シャーレ開放	1日目より表面が黄変したが、他は変化なし

②²⁾

苛酷試験	保存条件			試験結果
	照射光	形態	期間	
	室内散光*1	無色瓶密栓	6ヵ月	ほとんど変化は認められない。
	室内散光*1	褐色瓶密栓	6ヵ月	ほとんど変化は認められない。
	UV照射*2	シャーレ開放	3日	1日目より表面の黄変が認められた。

*1. 室内散光 (白色蛍光灯 500lx, 1日12時間照射)

*2. UV照射 (東芝健康用蛍光灯 20W, 照射距離 50cm, 連続照射)

試験項目: 性状 (融点), 確認試験, 純度試験, 比旋光度, 立体異性体比, 乾燥減量, 含量

その他

①¹⁾

		保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験		室温	42ヵ月	褐色ガラス瓶・密栓	ほとんど変化なし
加速試験		40°C/75%RH	6ヵ月	褐色瓶・開放	ほとんど変化なし
苛酷試験	粉末状態	50°C	2ヵ月	褐色瓶・密栓	ほとんど変化なし
	水溶液 (0.05W/v%)	白色蛍光灯 (2000lx)、 水溶液	30日	水に溶解。無色アンプルに封入。	14日目より黄変し、TLC、定量で7日目より分解物による変化が認められた。

②²⁾

(1) 長期保存試験

保存条件	試験開始時	室温 (褐色ガラス瓶)						
		6 ヶ月	1 年	1 年 6 ヶ月	2 年	2 年 6 ヶ月	3 年	3 年 6 ヶ月
試験項目								
外観	白色の結晶性の粉末, 無臭, 味は苦い	(-)	(-)	(-)	(-)	(-)	(-)	(-)
含量 (%)	99.2	99.0	99.2	99.3	99.4	100.3	99.1	99.5
旋光度 (°)	+179.6	+180.8	+183.0	+178.6	+179.9	+177.9	+179.0	+178.7
溶状	無色透明	(-)	(-)	(-)	(-)	(-)	(-)	(-)
呈色反応	赤紫色を呈する	/	(-)	/	(-)	/	(-)	(-)
乾燥減量 (%)	3.17	3.25	3.44	3.28	3.31	3.43	3.44	3.03

(一) : 試験開始時と比較してほとんど変化を認めない

(2) 苛酷試験

	保存条件					試験結果
	温度	湿度	照射光	形態	期間	
苛酷試験	50℃	/	/	褐色瓶密栓	2 ヶ月	ほとんど変化は認められない。
	40℃	75%RH	/	褐色瓶密栓	6 ヶ月	ほとんど変化は認められない。
	40℃	75%RH	/	褐色瓶開放	6 ヶ月	ほとんど変化は認められない。

試験項目 : 性状 (融点), 確認試験, 純度試験, 比旋光度, 立体異性体比, 乾燥減量, 含量

(3) 溶液中での安定性

保存条件	期間	試験結果
白色蛍光灯 2000lx	30 日	14 日目より黄変し、TLC、定量で 7 日目より分解物による変化が認められた。

試験は 0.05W/V% 水溶液としてアンプルに封入して行った。

膜透過性	なし
BCS ・ Biowaiver option	なし
薬効分類	219 その他の循環器官用薬
規格単位	【後発医薬品】 10mg 20mL 1 管 10mg 20mL 1 筒 【先発医薬品】 10mg 2mL 1 管

【記載データ一覧】

	品目名	製造販売業者	BE	品質 再評価	純度	検査
1	アルガトロバン注射液10mg「サワイ」	沢井製薬	記載 対象 外	記載 対象 外		
2	アルガトロバン注射液10mg「日医工」	日医工				
3	アルガトロバン注射液10mg「SN」	シオノケミカル				
4	アルガトロバン注シリンジ10mg「NP」	ニプロ				
5	アルガトロバン注10mgシリンジ「SN」	シオノケミカル				

注)「BE」は、生物学的同等性(BE)試験結果を示す。有効成分が完全に溶解した注射剤で血管内に直接投与するものについては、血中濃度の推移を変化させる要因が存在しないため、生物学的同等性試験は不要である。

【6 ページ】

注)「品質再評価」は品質再評価結果通知が発出されている品目を示す。品質再評価は、内用固形製剤の溶出性を溶出試験で確認したものであり、注射剤は検討対象外である。【7 ページ】

注)「純度」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での純度試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である(上記表中の番号は、本情報集に掲載された純度試験結果中の番号と対応している)。全品目で空欄となっている場合は、純度試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【8 ページ】

注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【9 ページ】

【生物学的同等性（BE）試験結果】

記載対象外

【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】

記載対象外

【純度試験結果（ジェネリック医薬品品質情報検討会）】

なし

【後発医薬品品質確保対策事業検査結果】

なし

【分析法（純度試験）】

なし

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) スロンノン HI 注 10mg/2mL (製造販売元：第一三共株式会社) 医薬品インタビューフォーム (2016 年 3 月改訂、第 12 版)
- 2) ノバスタン HI 注 10mg/2mL (製造販売元：田辺三菱製薬株式会社) 医薬品インタビューフォーム (2016 年 3 月改定、第 10 版)