

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2023.03.23 初版

有効成分	アクタリット	
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	アクタリット錠100mg「TOA」 東亜薬品
	2	アクタリット錠100mg「サワイ」 沢井製薬
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	モーバー錠100mg 田辺三菱製薬
	②	オークル錠100mg 日本新薬
効能・効果	https://www.bbdb.jp	
用法・用量	https://www.bbdb.jp	
添加物	https://www.bbdb.jp	
解離定数 ¹⁾	pKa : 3.94	
溶解度 ¹⁾ (37℃)	pH1.2 : 6.76mg/mL pH4.0 : 7.61mg/mL pH6.8 : 9.26mg/mL 水 : 6.68mg/mL	
原薬の安定性 ¹⁾	水	なし
	液性(pH)	1N塩酸及び1N水酸化ナトリウム(80℃)によりアミド結合が加水分解
	光	なし
	その他	なし
膜透過性	なし	
BCS・Biowaiver option	なし	
薬効分類	114 解熱鎮痛消炎剤	
規格単位	100mg 1錠	

【記載データ一覧】

	品目名	製造販売業者	BE	品質 再評価	溶出	検査
1	アクタリット錠100mg「TOA」	東亜薬品	○		No.5	○
2	アクタリット錠100mg「サワイ」	沢井製薬	○		No.4	○

注)「BE」は、生物学的同等性(BE)試験結果を示し、○印がついているものは本情報集にデータを掲載している。【3ページ】

注)「品質再評価」の項目に○印がついているものは、品質再評価結果通知²⁾が発出されている品目である。空欄となっているものは、品質再評価指定以降に承認された品目等である。なお、参考として、品質再評価の際の先発医薬品の溶出曲線測定例を本情報集に掲載している。【4ページ】

注)「溶出」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果を示し、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溶出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、溶出試験未実施である。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。【5~6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。【7ページ】

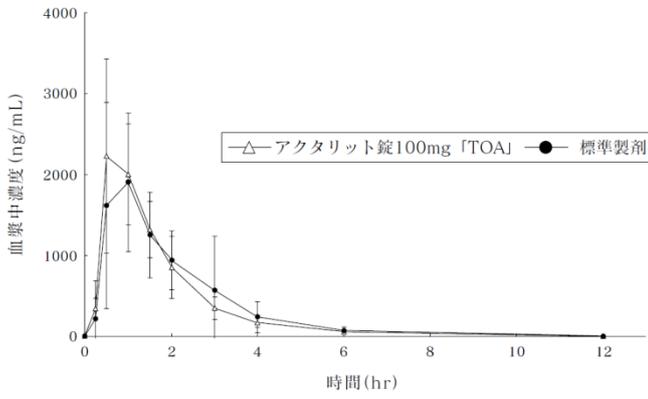
【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1

1錠投与

血漿中未変化体濃度

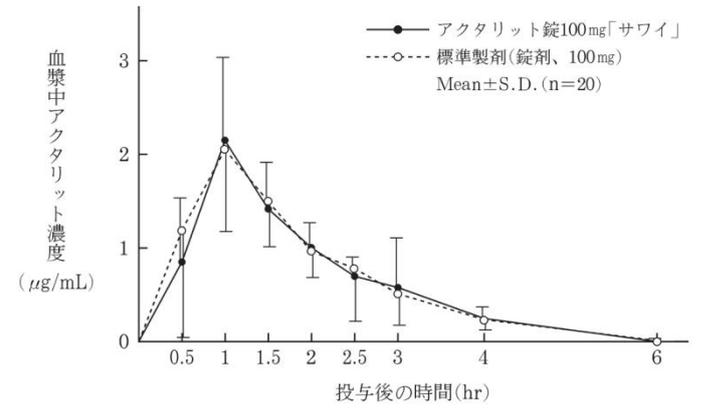
(平均値±標準偏差、n=19)



標準製剤 (錠剤、100mg)

2

1錠投与



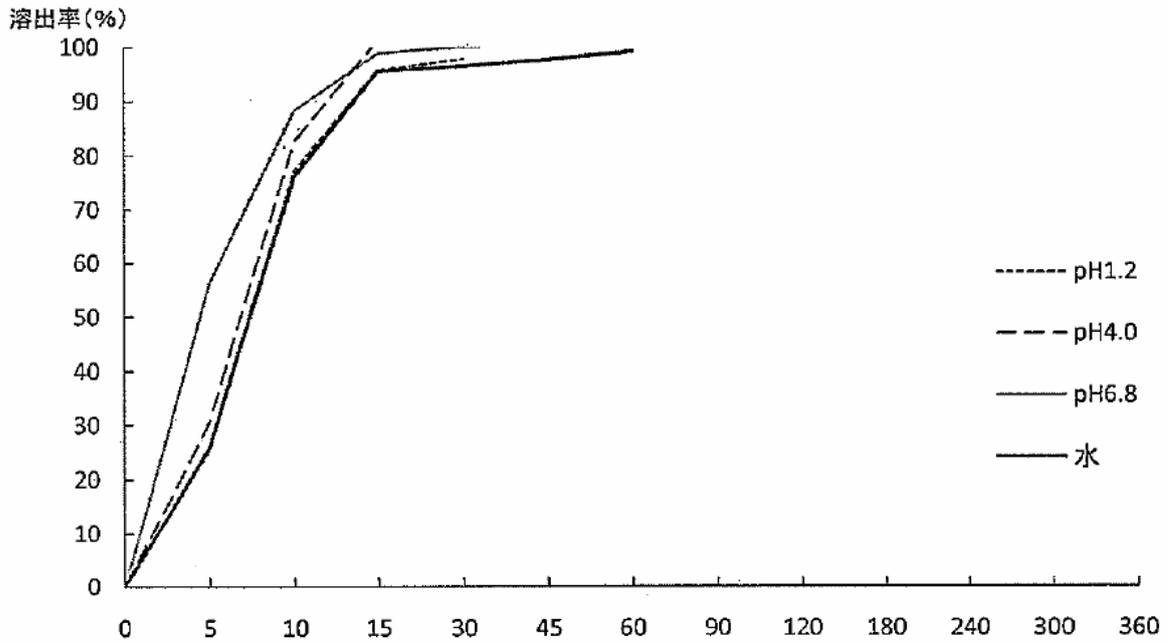
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

アクタリット錠100mg

- | | | |
|----------------------------|--------------|-------------|
| 1. 有効成分名：アクタリット | 2. 剤形：錠剤 | 3. 含量：100mg |
| 4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水 | 5. 回転数：50rpm | |
| 6. 界面活性剤：使用せず | | |



製剤 No	製品名	製造販売元	ロット番号	使用期限	備考
No. 1	オークル錠 100mg	日本新薬(株)	112701	2020. 12	先発医薬品
No. 2	モーバー錠 100mg	田辺三菱製薬(株)	X179	2020. 11	先発医薬品
No. 3	アクタリット錠 100「TCK」	辰巳化学(株)	AKDI	2018. 11	承認整理済み
No. 4	アクタリット錠 100mg「サワイ」	沢井製薬(株)	16101	2019. 01	
No. 5	アクタリット錠 100mg「TOA」	東亜薬品(株)	Y02YS	2017. 08	

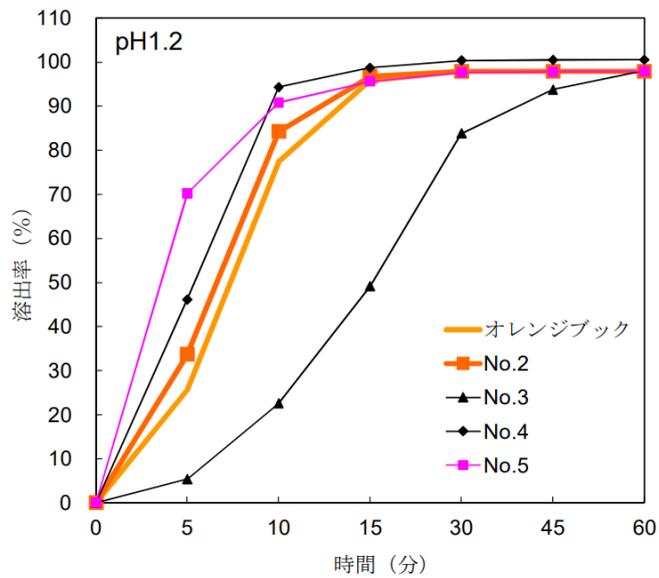


図 59 アクタリット錠の pH1.2 における溶出挙動

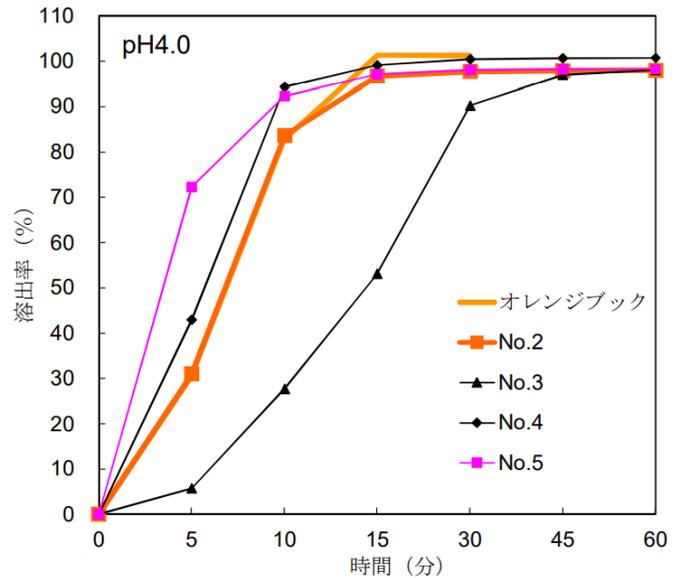


図 60 アクタリット錠の pH4.0 における溶出挙動

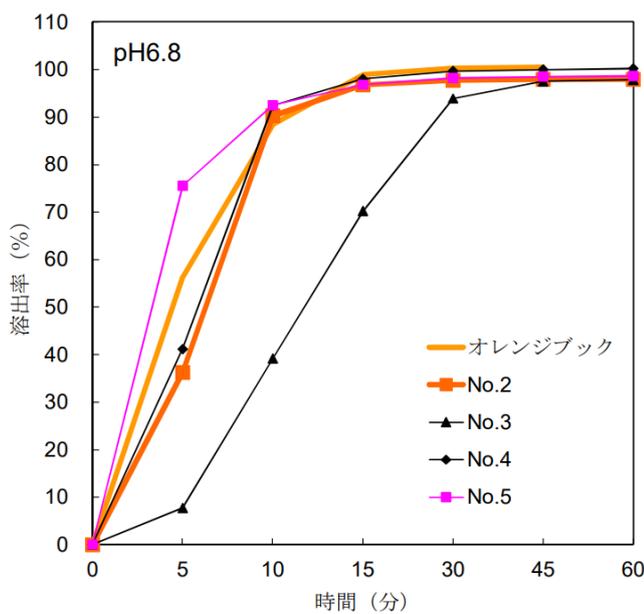


図 61 アクタリット錠の pH6.8 における溶出挙動

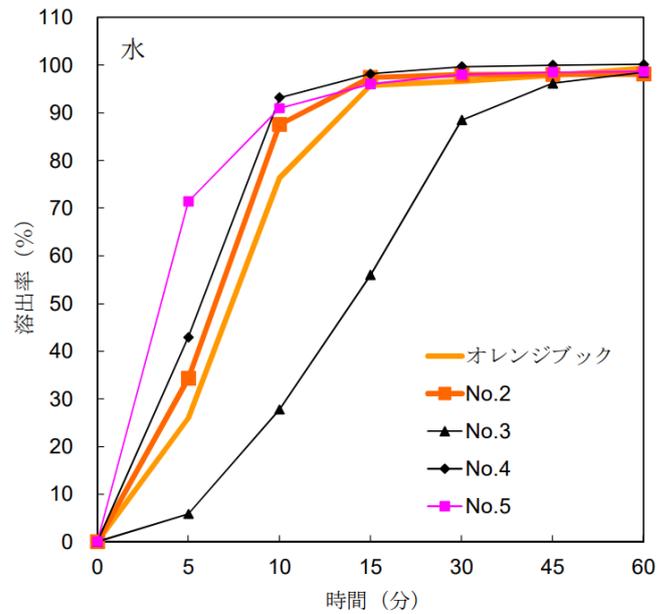


図 62 アクタリット錠の水における溶出挙動

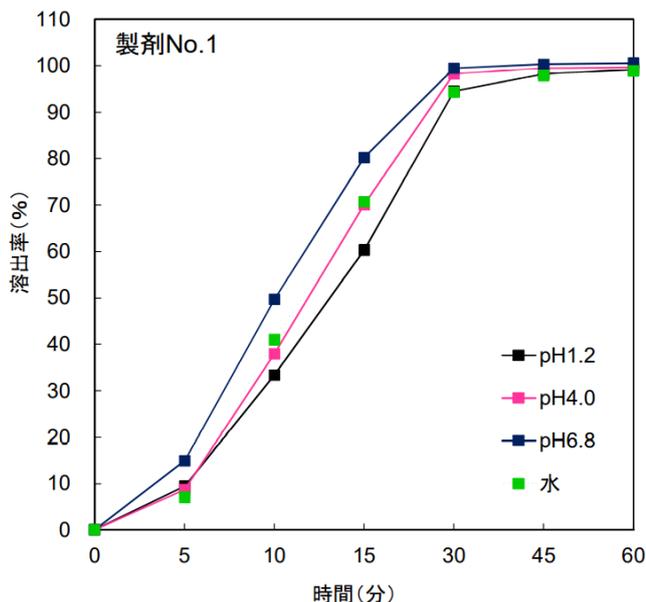


図 63 アクタリット錠（製剤 No.1）の溶出挙動

各試験液における溶出曲線を図 59～63 に示す。図 59～62 は製剤 No. 2～No. 5、図 63 は製剤 No. 1 の 4 液性の溶出曲線である。製剤 No. 1 以外の公的溶出規格は、水を試験液として、毎分 50 回転で試験を行なうとき、30 分間の溶出率が 80% 以上であり、いずれの製剤も規格に適合していた（図 62）。

溶出挙動を比較したとき、製剤 No. 4 および製剤 No. 5 はすべての試験液でオレンジブックおよび先発製剤の溶出挙動と類似の範囲にあった。一方、製剤 No. 3 はいずれの試験液においても溶出が遅く、4 液全てにおいて先発製剤およびオレンジブックの溶出曲線と類似の範囲になかった。

製剤 No. 3 のメーカーに問い合わせたところ、メーカー実施の試験において、当該ロットでは同様に溶出が遅かったものの、直近 2 ロットの溶出挙動は類似の範囲にあることが確認された。そのため、ロット間で溶出挙動が異なっている原因について、調査を進めるとの回答があった。

【後発医薬品品質確保対策事業検査結果】⁴⁾

平成 28 年度（溶出試験） 適

アクタリット錠
Actarit Tablets

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50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0.45 μ m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1mLを正確に量り、表示量に従い1mL中にアクタリット(C₁₀H₁₁NO₃)約11 μ g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。別にアクタリット標準品を105°Cで2時間乾燥し、その約22mgを精密に量り、水に溶かし、正確に200mLとする。この液2mLを正確に量り、水を加えて正確に20mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、紫外可視吸光度測定法〈2.24〉により試験を行い、波長244nmにおける吸光度A₁及びA₂を測定する。

本品が溶出規格を満たすときは適合とする。

アクタリット(C₁₀H₁₁NO₃)の表示量に対する溶出率(%)

$$= W_3 \times (A_1/A_2) \times (V' / V) \times (1/C) \times 45$$

W₃: アクタリット標準品の秤取量(mg)

C: 1錠中のアクタリット(C₁₀H₁₁NO₃)の表示量(mg)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
100mg	30分	80%以上

アクタリット標準品 C₁₀H₁₁NO₃: 193.20 4-アセチルアミノフェニル酢酸で、下記の規格に適合するもの。必要な場合、次に示す方法により精製する。

精製法 アクタリット10gをアセトン/水混液(1:1)30mLに加温して溶かし、不溶物をろ過する。ろ液を室温まで水冷後、一夜放置し、白色の結晶を析出させる。得られた結晶は、50~60°Cで8時間乾燥する。

性状 本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。

確認試験 本品を乾燥し、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3330cm⁻¹、1695cm⁻¹、1641cm⁻¹、1601cm⁻¹、1284cm⁻¹、1262cm⁻¹及び738cm⁻¹付近に吸収を認める。

純度試験 類縁物質 本品0.10gをアセトン10mLに溶かし、試料溶液とする。この液1mLを正確に量り、アセトンを加えて正確に25mLとする。この液2mLを正確に量り、アセトンを加えて正確に20mLとし、標準溶液とする。これらの液につき、薄層クロマトグラフィー〈2.03〉により試験を行う。試料溶液及び標準溶液10 μ Lずつを薄層クロマトグラフィー用シリカゲル(蛍光剤入り)を用いて調製した薄層板にスポットする。次にテトラヒドロフラン/ヘキサン/酢酸(100)/水混液(20:10:2:1)を展開溶媒として約10cm展開した後、薄層板を風乾する。これに紫外線(主波長254nm)を照射するとき、試料溶液から得た主スポット以外のスポットは、標準溶液から得たスポットより濃くない。

乾燥減量 〈2.41〉 0.5%以下(1g, 105°C, 2時間)。

含量 99.0%以上。定量法本品を乾燥し、その約0.3gを精密に量り、エタノール(95)30mLに溶かし、0.1mol/L水酸化ナトリウム液で滴定〈2.50〉する(電位差滴定法)。同様の方法で空試験を行い、補正する。

0.1mol/L水酸化ナトリウム液1mL=19.32mg C₁₀H₁₁NO₃

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) 医療用医薬品品質情報集（オレンジブック）（平成 22 年 2 月版、厚生労働省医薬食品局審査管理課）
- 2) 医療用医薬品再評価結果 平成 19 年度（その 4）について（平成 20 年 1 月 7 日付け薬食発第 0107001 号、厚生労働省医薬食品局長）
- 3) 第 19 回ジェネリック医薬品品質情報検討会 資料 19-1
- 4) 平成 28 年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成 30 年 6 月、厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課）
- 5) 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 20 年 1 月 7 日付け薬食発第 0107005 号、厚生労働省医薬食品局長通知）