

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2019. 04. 24 初版

有効成分	オキサトミド																						
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	オキサトミドシロップ小児用0.2%「ファイザー」	マイラン製薬																				
	2	オキサトーフDS小児用2%	東和薬品																				
	3	セルトミドドライシロップ2%	小林化工																				
	4	トーラスタンDS2%	高田製薬																				
	5	オキサトミドドライシロップ小児用2%「イワキ」	岩城製薬																				
	6	オキサトミドドライシロップ小児用2%「日医工」	日医工																				
	7	オキサトミドドライシロップ小児用2%「ツルハラ」	鶴原製薬																				
	8	オキサトミドDS小児用2%「サワイ」	沢井製薬																				
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	セルテクトドライシロップ2%	協和発酵キリン																				
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⁾	pKa ₁ : 3.56（滴定法、ピペラジン環（4位N）） pKa ₂ : 7.20（滴定法、ピペラジン環（1位N））																						
溶解度 ¹⁾ (37℃)	pH1.2 : 6.6mg/mL pH5.5 : 0.048mg/mL pH6.8 : 0.0031mg/mL 水 : 0.0061mg/mL																						
原薬の安定性 ²⁾	水	なし																					
	液性(pH)	苛酷試験の結果は下記のとおりである。変化は認められず安定であった。																					
		<table border="1"> <thead> <tr> <th>試験名</th> <th>保存条件</th> <th>保存期間</th> <th>保存容器</th> <th>試験結果</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td rowspan="3">苛酷試験 溶液 (pH2,4,6,8)</td> <td>25℃</td> <td>7日</td> <td>アンプル</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>40℃</td> <td>7日</td> <td>アンプル</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>蛍光灯下 1,000Lux</td> <td>7日</td> <td>アンプル</td> <td>変化なし</td> </tr> </tbody> </table>				試験名	保存条件	保存期間	保存容器	試験結果	苛酷試験 溶液 (pH2,4,6,8)	25℃	7日	アンプル	変化なし	40℃	7日	アンプル	変化なし	蛍光灯下 1,000Lux	7日	アンプル	変化なし
試験名	保存条件	保存期間	保存容器	試験結果																			
苛酷試験 溶液 (pH2,4,6,8)	25℃	7日	アンプル	変化なし																			
	40℃	7日	アンプル	変化なし																			
	蛍光灯下 1,000Lux	7日	アンプル	変化なし																			
	光	苛酷試験の結果は下記のとおりである。キセノンランプの条件下で外観上わずかに変化が認められた以外は変化は認められず安定であった。																					
		<table border="1"> <thead> <tr> <th>試験名</th> <th>保存条件</th> <th>保存期間</th> <th>保存容器</th> <th>試験結果</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td rowspan="2">苛酷試験 曝光</td> <td>蛍光灯下 1,000Lux</td> <td>3ヵ月</td> <td>無色瓶、気密</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>キセノンランプ下 120,000Lux</td> <td>10日</td> <td>無色瓶、気密</td> <td>Initialと比較してわずかに外観変化がみられた。</td> </tr> </tbody> </table>				試験名	保存条件	保存期間	保存容器	試験結果	苛酷試験 曝光	蛍光灯下 1,000Lux	3ヵ月	無色瓶、気密	変化なし	キセノンランプ下 120,000Lux	10日	無色瓶、気密	Initialと比較してわずかに外観変化がみられた。				
試験名	保存条件	保存期間	保存容器	試験結果																			
苛酷試験 曝光	蛍光灯下 1,000Lux	3ヵ月	無色瓶、気密	変化なし																			
	キセノンランプ下 120,000Lux	10日	無色瓶、気密	Initialと比較してわずかに外観変化がみられた。																			

	その他	<p>長期保存試験、苛酷試験の結果は下記のとおりである。変化は認められず安定であった。</p> <table border="1" data-bbox="424 197 1469 611"> <thead> <tr> <th data-bbox="424 197 592 253">試験名</th> <th data-bbox="592 197 730 253">保存条件</th> <th data-bbox="730 197 900 253">保存期間</th> <th data-bbox="900 197 1094 253">保存容器</th> <th data-bbox="1094 197 1469 253">試験結果</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="424 253 592 309">長期保存試験</td> <td data-bbox="592 253 730 309">室温</td> <td data-bbox="730 253 900 309">42ヵ月</td> <td data-bbox="900 253 1094 309">無色瓶、気密</td> <td data-bbox="1094 253 1469 309">変化なし</td> </tr> <tr> <td data-bbox="424 309 464 611" rowspan="4">苛酷試験</td> <td data-bbox="464 309 592 365" rowspan="2">加温</td> <td data-bbox="592 309 730 365">40℃</td> <td data-bbox="730 309 900 365">6ヵ月</td> <td data-bbox="900 309 1094 365">無色瓶、気密</td> <td data-bbox="1094 309 1469 365">変化なし</td> </tr> <tr> <td data-bbox="592 365 730 421">60℃</td> <td data-bbox="730 365 900 421">30日</td> <td data-bbox="900 365 1094 421">無色瓶、気密</td> <td data-bbox="1094 365 1469 421">変化なし</td> </tr> <tr> <td data-bbox="464 421 592 521" rowspan="2">加温・加湿</td> <td data-bbox="592 421 730 521">25℃ 75%RH</td> <td data-bbox="730 421 900 521">6ヵ月</td> <td data-bbox="900 421 1094 521">無色瓶、開放</td> <td data-bbox="1094 421 1469 521">変化なし</td> </tr> <tr> <td data-bbox="592 521 730 611">40℃ 75%RH</td> <td data-bbox="730 521 900 611">6ヵ月</td> <td data-bbox="900 521 1094 611">無色瓶、開放</td> <td data-bbox="1094 521 1469 611">変化なし</td> </tr> </tbody> </table>	試験名	保存条件	保存期間	保存容器	試験結果	長期保存試験	室温	42ヵ月	無色瓶、気密	変化なし	苛酷試験	加温	40℃	6ヵ月	無色瓶、気密	変化なし	60℃	30日	無色瓶、気密	変化なし	加温・加湿	25℃ 75%RH	6ヵ月	無色瓶、開放	変化なし	40℃ 75%RH	6ヵ月	無色瓶、開放	変化なし
試験名	保存条件	保存期間	保存容器	試験結果																											
長期保存試験	室温	42ヵ月	無色瓶、気密	変化なし																											
苛酷試験	加温	40℃	6ヵ月	無色瓶、気密	変化なし																										
		60℃	30日	無色瓶、気密	変化なし																										
	加温・加湿	25℃ 75%RH	6ヵ月	無色瓶、開放	変化なし																										
		40℃ 75%RH	6ヵ月	無色瓶、開放	変化なし																										
膜透過性	なし																														
BCS・Biowaiver option	なし																														
薬効分類	449 その他のアレルギー用薬																														
規格単位	O. 2% 1 mL 2% 1 g																														

【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	オキサトミドシロップ小児用0.2%「ファイザー」	マイラン製薬	○			
2	オキサトーフDS小児用2%	東和薬品	○	○*		
3	セルトミドドライシロップ2%	小林化工	○	○*		
4	トーラストンDS2%	高田製薬	○	○*		
5	オキサトミドドライシロップ小児用2%「イワキ」	岩城製薬	○	○*		
6	オキサトミドドライシロップ小児用2%「日医工」	日医工	○	○*		
7	オキサトミドドライシロップ小児用2%「ツルハラ」	鶴原製薬	○	○*		
8	オキサトミドDS小児用2%「サワイ」	沢井製薬	○	○*		

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。【4~5 ページ】

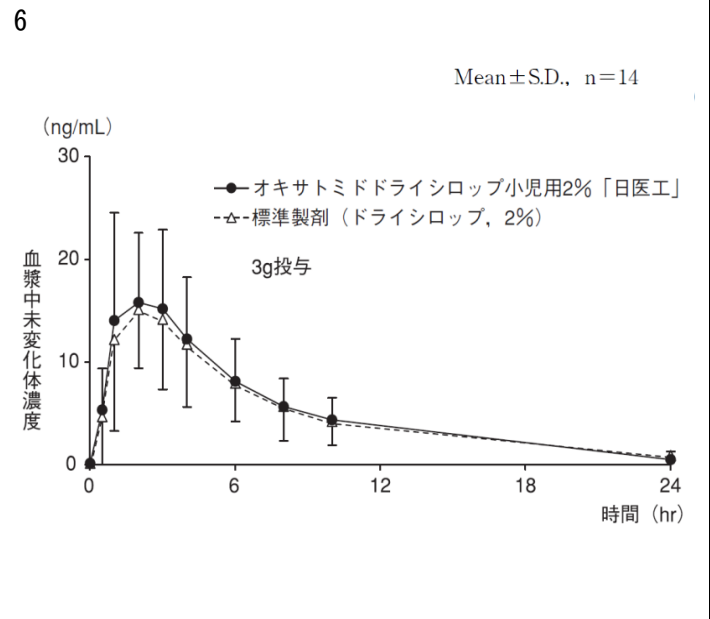
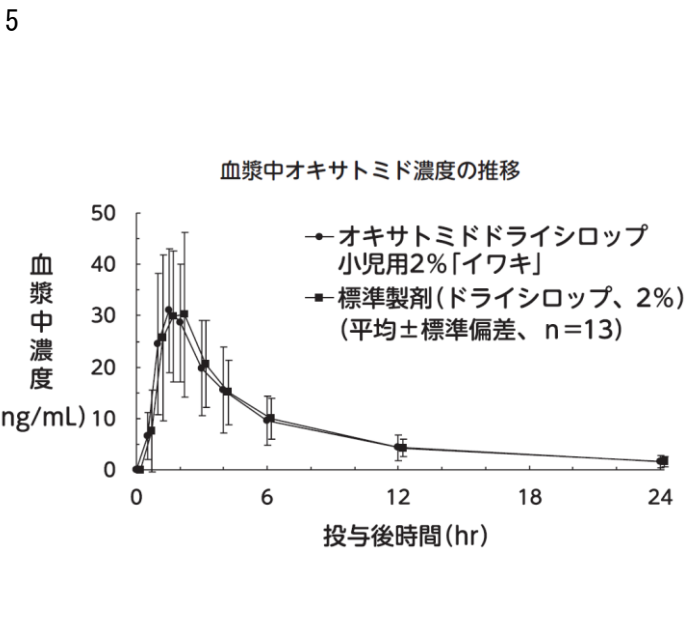
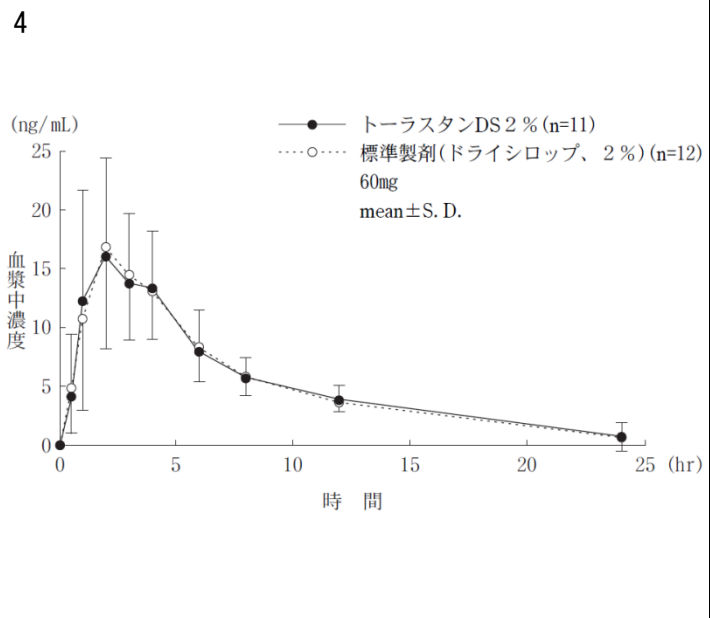
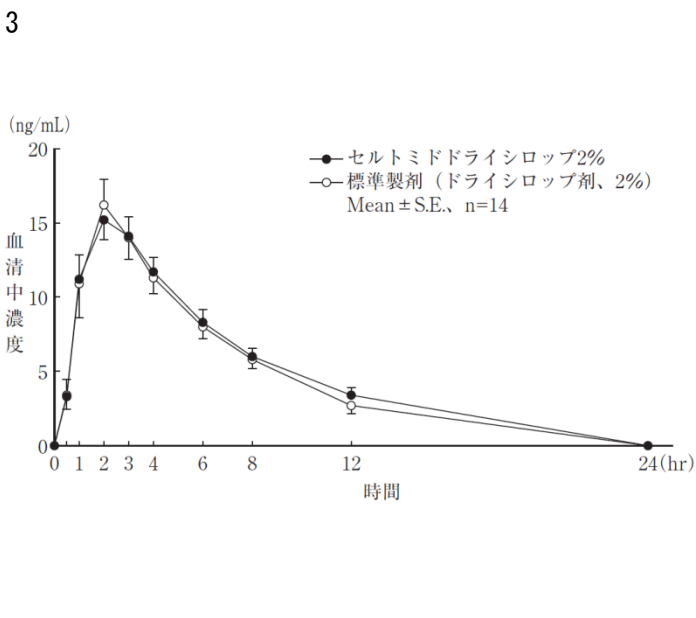
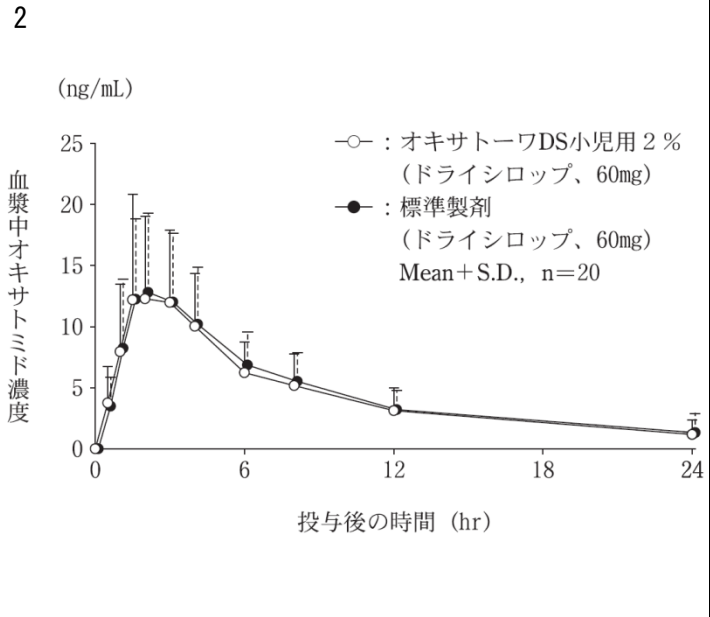
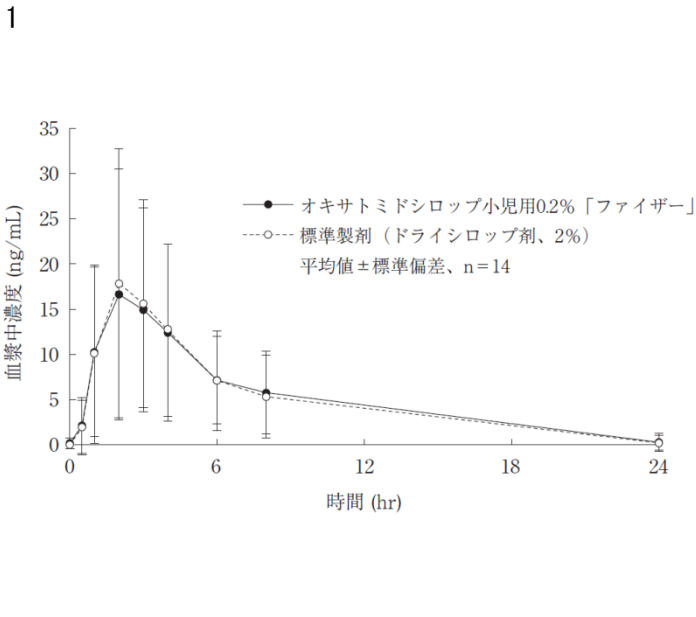
注)「品質再評価」の項目に○印がついているものは、品質再評価結果通知³⁾が発出されている品目である。空欄となっているものは、品質再評価指定以降に承認された品目等である。なお、参考として、品質再評価の際の先発医薬品の溶出曲線測定例を本情報集に掲載している。【6 ページ】

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。【7 ページ】

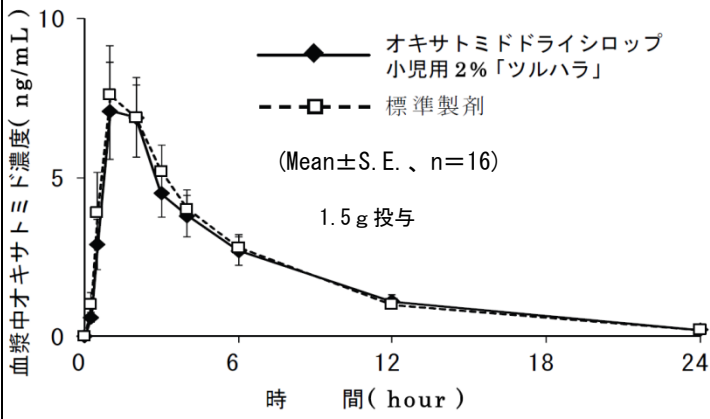
注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【8 ページ】

*: 旧販売名で記載

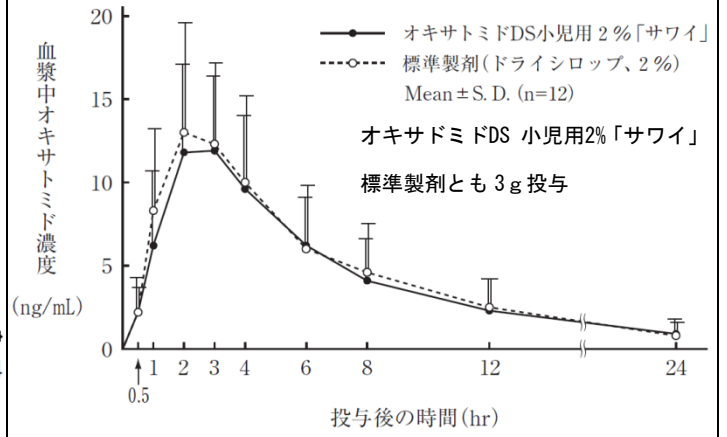
【生物学的同等性 (BE) 試験結果】



7



8



【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

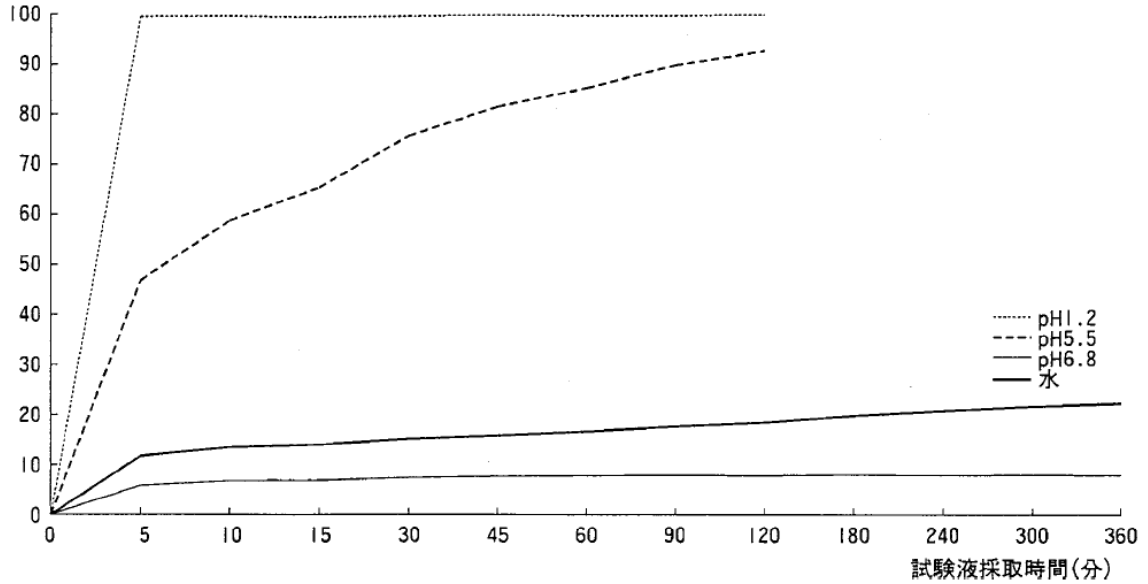
※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

オキサトミドシロップ用2%

溶出率(%)

- 1. 有効成分名：オキサトミド
- 2. 剤形：ドライシロップ
- 3. 含量：20mg/g
- 4. 試験液：pH1.2、pH5.5、pH6.8、水
- 5. 回転数：50rpm
- 6. 界面活性剤：使用せず



【溶出試験結果（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

オキサトミドドライシロップ

Oxatomide Dry Syrup

溶出試験 本品の表示量に従いオキサトミド($C_{27}H_{30}N_4O$)約 0.03g に対応する量を精密に量り、試験液に pH5.5 のリン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液 900mL を用い、溶出試験法第 2 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 4mL を正確に量り、0.5mol/L 塩酸試液を加えて正確に 5mL とし、試料溶液とする。別にオキサトミド標準品を酸化リン(V)を乾燥剤として 80°C で 4 時間減圧乾燥し、その約 0.027g を精密に量り、0.5mol/L 塩酸試液に溶かし、正確に 200mL とする。この液 10mL を正確に量り、pH5.5 のリン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液を加えて正確に 50mL 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により試験を行い、波長 279nm における吸光度 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。

オキサトミド($C_{27}H_{30}N_4O$)の表示量に対する溶出率(%)

$$= \frac{W_S}{W_T} \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{1}{C} \times \frac{225}{2}$$

W_S : オキサトミド標準品の量 (mg)

W_T : オキサトミドドライシロップの秤取量 (g)

C : 1g 中のオキサトミド($C_{27}H_{30}N_4O$)の表示量 (mg)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
20mg/g	60 分	70%以上

オキサトミド標準品 「オキサトミド」。ただし、乾燥したものを定量するとき、オキサトミド($C_{27}H_{30}N_4O$) 99.0% 以上を含むもの。

リン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液, pH5.5 無水リン酸水素二ナトリウム 7.1g を水に溶かし、1000mL とする。この液にクエン酸一水和物 5.25g を水に溶かして 1000mL とした液を加え、pH5.5 に調整する。

【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 13 年 5 月版、厚生労働省医薬局審査管理課）
- 2) セルテクト錠 30／ドライシロップ 2%（製造販売元：協和発酵キリン株式会社）医薬品インタビューフォーム（2015 年 9 月改訂）
- 3) 医療用医薬品再評価結果 平成 13 年度（その 1）について（平成 13 年 4 月 25 日付け医薬発第 444 号、厚生労働省医薬局長）
- 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 13 年 4 月 25 日付け医薬発第 441 号、厚生労働省医薬局長通知）