

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2021. 12. 03 第2版（2018. 7. 13 初版）

|                            |  |                                    |         |
|----------------------------|--|------------------------------------|---------|
| 有効成分                       | ハロペリドール  |                                    |         |
| 品目名（製造販売業者）<br>【後発医薬品】     | 1  | ハロペリドール細粒1%「トーフ」                   | 東和薬品    |
|                            | 2  | ハロペリドール細粒1%「タカタ」                   | 高田製薬    |
|                            | 3  | ハロペリドール細粒1%「ツルハラ」                  | 鶴原製薬    |
|                            | 4  | ハロペリドール細粒1%「アメル」                   | 共和薬品工業  |
|                            | 5  | ハロペリドール細粒1%「ヨシトミ」                  | 田辺三菱製薬  |
| 品目名（製造販売業者）<br>【先発医薬品】     | ①  | セレネース細粒1%                          | 大日本住友製薬 |
| 効能・効果                      | <a href="http://www.bbdb.jp">http://www.bbdb.jp</a>                            |                                    |         |
| 用法・用量                      | <a href="http://www.bbdb.jp">http://www.bbdb.jp</a>                            |                                    |         |
| 添加物                        | <a href="http://www.bbdb.jp">http://www.bbdb.jp</a>                            |                                    |         |
| 解離定数 <sup>1)</sup>         | pKa : 8.25（ピペリジン環、滴定法）   |                                    |         |
| 溶解度 <sup>1)</sup><br>(37℃) | pH1.2 : 0.78 mg/mL<br>pH4.0 : 10 mg/mL<br>pH6.8 : 0.038mg/mL<br>水 : 0.010mg/mL |                                    |         |
| 原薬の安定性 <sup>1)</sup>       | 水  | 37℃、48時間は安定である。                    |         |
|                            | 液性(pH)   | pH1.2、pH4.0及びpH6.8、37℃、48時間は安定である。 |         |
|                            | 光  | なし                                 |         |
|                            | その他  | なし                                 |         |
| 膜透過性                       | なし   |                                    |         |
| BCS・Biowaiver option       | なし   |                                    |         |
| 薬効分類                       | 117 精神神経用剤   |                                    |         |
| 規格単位                       | 1% 1g  |                                    |         |

【記載データ一覧】

|   | 品目名               | 製造販売業者 | BE | 品質<br>再評価 | 溶出 | 検査 |
|---|-------------------|--------|----|-----------|----|----|
| 1 | ハロペリドール細粒1%「トーフ」  | 東和薬品   | ○+ | ○*        |    | ○  |
| 2 | ハロペリドール細粒1%「タカタ」  | 高田製薬   |    | ○*        |    | ○* |
| 3 | ハロペリドール細粒1%「ツルハラ」 | 鶴原製薬   | ○+ | ○*        |    | ○  |
| 4 | ハロペリドール細粒1%「アメル」  | 共和薬品工業 |    | ○*        |    | ○* |
| 5 | ハロペリドール細粒1%「ヨシトミ」 | 田辺三菱製薬 |    | ○*        |    | ○* |

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。○印の右に+印がついているものは動物試験のデータ。【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<sup>2)</sup>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】

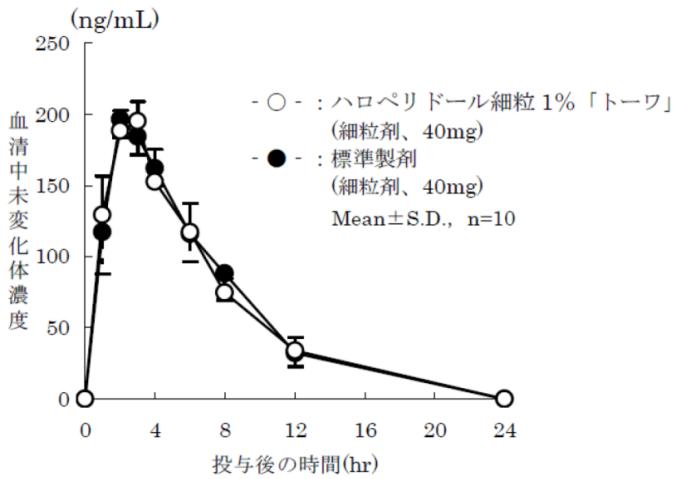
注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【6ページ】

\*: 旧販売名で記載

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1 <参考>

雌性ビーグル犬



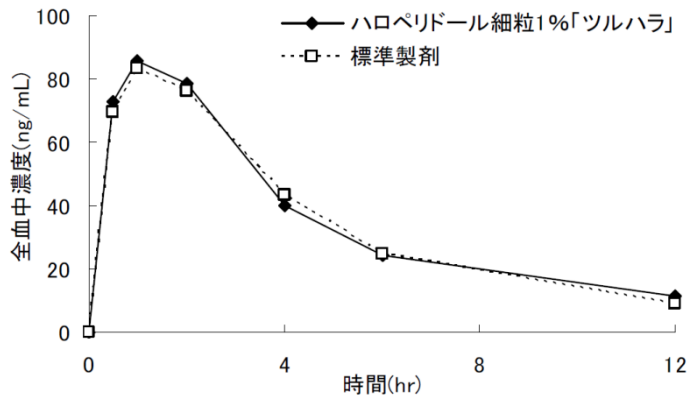
(インタビューフォームより)

2

なし

3 <参考>

家兔



(インタビューフォームより)

4

なし

5

なし

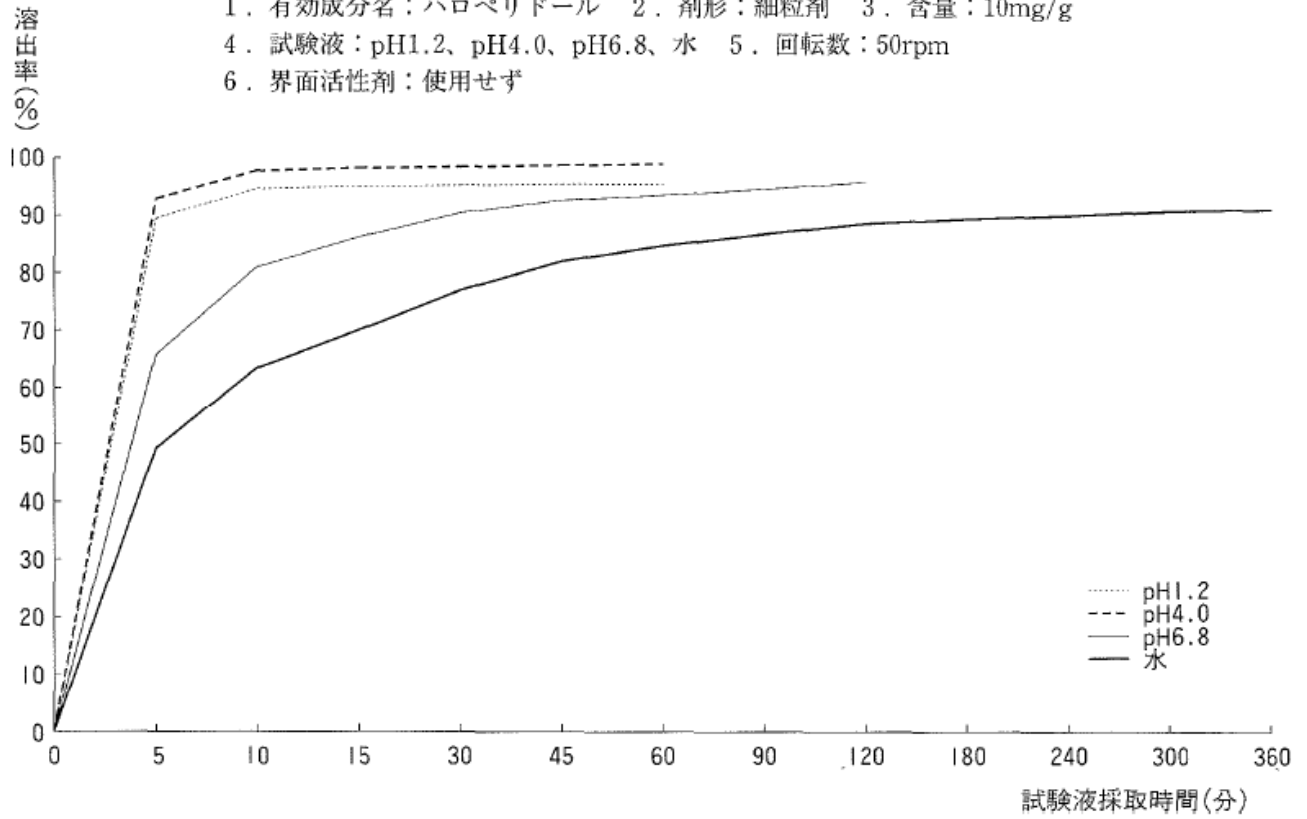
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】<sup>1)</sup>

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

ハロペリドール細粒1%

1. 有効成分名：ハロペリドール
2. 剤形：細粒剤
3. 含量：10mg/g
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



【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】<sup>3)</sup>

|                  |
|------------------|
| 平成 22 年度（溶出試験） 適 |
|------------------|

ハロペリドール細粒  
Haloperidol Fine Granules

**溶出性** 〈6.10〉 試験液に水900mLを用い、パドル法により、毎分50回転で試験を行うとき、本品の60分間の溶出率は70%以上である。

本品のハロペリドール ( $C_{21}H_{23}ClFNO_2$ ) 約3mgに対応する量を精密に量り、試験を開始し、規定された時間に溶出液20mL以上をとり、孔径0.45  $\mu$ 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5mLを正確に量り、水を加えて正確に20mLとし、試料溶液とする。別に定量用ハロペリドールを酸化リン(V)を乾燥剤として60°Cで3時間減圧乾燥し、その約17mgを精密に量り、メタノールに溶かし、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200mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液100  $\mu$ L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、それぞれの液のハロペリドールのピーク面積 $A_1$ 及び $A_2$ を測定する。

ハロペリドール ( $C_{21}H_{23}ClFNO_2$ ) の表示量に対する溶出率 (%)

$$= M_2/M_1 \times A_1/A_2 \times 1/C \times 18$$

$M_2$  : 定量用ハロペリドールの秤取量 (mg)

$M_1$  : 本品の秤取量 (g)

$C$  : 1g中のハロペリドール ( $C_{21}H_{23}ClFNO_2$ ) の表示量 (mg)

試験条件

カラム、カラム温度、移動相及び流量は定量法の試験条件を準用する。

カラム : 内径4.6mm, 長さ15cmのステンレス管に5  $\mu$ m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填する。

カラム温度 : 40°C付近の一定温度

移動相 : クエン酸三ナトリウム二水和物2.95gを水900mLに溶かし、希塩酸を加えてpH3.5に調整した後、水を加えて1000mLとする。この液250mLにメタノール750mLを加え、更にラウリル硫酸ナトリウム1.0gを加えて溶かす。

流量 : ハロペリドールの保持時間が約9分になるように調整する。

検出器 : 紫外吸光光度計 (測定波長 : 245nm)

システム適合性

システムの性能 : 標準溶液100  $\mu$ Lにつき、上記の条件で操作するとき、ハロペリドールのピークの理論段数及びシンメトリー係数は、それぞれ4000段以上、2.0以下である。

システムの再現性 : 標準溶液100  $\mu$ Lにつき、上記の条件で試験を6回繰り返すとき、ハロペリドールのピーク面積の相対標準偏差は2.0%以下である。

**【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 16 年 6 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 16 年度（その 1）について（平成 16 年 5 月 17 日付け薬食発第 0517002 号、厚生労働省医薬食品局長）
- 3) 平成 22 年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成 23 年 7 月、厚生労働省医薬食品局監視指導・麻薬対策課）
- 4) 第十七改正日本薬局方（平成 28 年 3 月 7 日厚生労働省告示第 64 号）