

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（2019. 04. 24 初版）

有効成分	ニプラジロール																			
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	ニプラジロール点眼液 0. 25% 「ニットー」			東亜薬品															
	2	ニプラジロール点眼液 0. 25% 「サワイ」			沢井製薬															
	3	ニプラジロール点眼液 0. 25% 「ニッテン」			ニッテン															
	4	ニプラジロールPF点眼液 0. 25% 「日点」			日本点眼薬研究所															
	5	ニプラジロール点眼液 0. 25% 「わかもと」			わかもと製薬															
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	ニプラノール点眼液 0. 25%			テイカ製薬															
	②	ハイパジールコーワ点眼液 0. 25%			興和															
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	pKa : 9. 58 ¹⁾ pKa : 9. 58 (pH 滴定法) ²⁾																			
溶解度 ^{1) 2)}	水 1753. 3mL (本品 1g を溶解する溶媒の量)、極めて溶けにくい。(日本薬局方による表現)																			
原薬の安定性	水 ¹⁾	なし																		
	液性 (pH)	<table border="1"> <thead> <tr> <th colspan="2">項目</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="2">溶液状態</td> <td>pH 1. 2</td> <td rowspan="2">室内散光 37℃</td> <td rowspan="2">3日</td> <td rowspan="2"></td> <td rowspan="2">変化なし</td> </tr> <tr> <td>pH 6. 8</td> </tr> </tbody> </table>				項目		保存条件	保存期間	保存形態	結果	溶液状態	pH 1. 2	室内散光 37℃	3日		変化なし	pH 6. 8		
	項目		保存条件	保存期間	保存形態	結果														
溶液状態	pH 1. 2	室内散光 37℃	3日		変化なし															
	pH 6. 8																			
光	<table border="1"> <thead> <tr> <th colspan="2">項目</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="2">固体状態</td> <td rowspan="2">過酷試験</td> <td>室内散光</td> <td>12ヶ月</td> <td>気密容器</td> <td>外観に経時変化を認める。</td> </tr> <tr> <td>直射日光</td> <td>10時間</td> <td>開放容器</td> <td>外観に経時的に黄色の着色と共に分解物がみられる。 (分解物は脱ニトロニプラジロール及び HNB*であった。)</td> </tr> </tbody> </table> <p>¹⁾</p> <p>* : 3, 4-dihydro-8-hydroxy-3-nitroxy-2H-1-benzopyran</p>				項目		保存条件	保存期間	保存形態	結果	固体状態	過酷試験	室内散光	12ヶ月	気密容器	外観に経時変化を認める。	直射日光	10時間	開放容器	外観に経時的に黄色の着色と共に分解物がみられる。 (分解物は脱ニトロニプラジロール及び HNB*であった。)
項目		保存条件	保存期間	保存形態	結果															
固体状態	過酷試験	室内散光	12ヶ月	気密容器	外観に経時変化を認める。															
		直射日光	10時間	開放容器	外観に経時的に黄色の着色と共に分解物がみられる。 (分解物は脱ニトロニプラジロール及び HNB*であった。)															
		<table border="1"> <thead> <tr> <th>項目</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="2">苛酷試験</td> <td>室内散光</td> <td>12ヵ月</td> <td>気密容器</td> <td>外観 (色) の経時変化</td> </tr> <tr> <td>直射日光</td> <td>10時間</td> <td>開放容器</td> <td>外観及び溶状 (色) の経時変化、吸光度の経時的増加、TLC のスポット増加、含量の経時的減少</td> </tr> </tbody> </table> <p>²⁾</p>				項目	保存条件	保存期間	保存形態	結果	苛酷試験	室内散光	12ヵ月	気密容器	外観 (色) の経時変化	直射日光	10時間	開放容器	外観及び溶状 (色) の経時変化、吸光度の経時的増加、TLC のスポット増加、含量の経時的減少	
項目	保存条件	保存期間	保存形態	結果																
苛酷試験	室内散光	12ヵ月	気密容器	外観 (色) の経時変化																
	直射日光	10時間	開放容器	外観及び溶状 (色) の経時変化、吸光度の経時的増加、TLC のスポット増加、含量の経時的減少																
測定項目 : 性状、UV、IR、吸光度、溶状、TLC、乾燥減量、異性体比、含量																				

その他	<table border="1"> <tr> <td colspan="2">項目</td> <td>保存条件</td> <td>保存期間</td> <td>保存形態</td> <td>結果</td> </tr> <tr> <td rowspan="3">固 体 状 態</td> <td>長期保存試験</td> <td>室温</td> <td>39ヶ月</td> <td>遮光・ 気密容器</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td rowspan="2">過酷試験</td> <td>50℃</td> <td>6ヶ月</td> <td>遮光・ 気密容器</td> <td>わずかに着色したが 安定であった。</td> </tr> <tr> <td>40℃ 75%RH</td> <td>6ヶ月</td> <td>遮光・ 気密容器</td> <td>変化なし</td> </tr> </table>					項目		保存条件	保存期間	保存形態	結果	固 体 状 態	長期保存試験	室温	39ヶ月	遮光・ 気密容器	変化なし	過酷試験	50℃	6ヶ月	遮光・ 気密容器	わずかに着色したが 安定であった。	40℃ 75%RH	6ヶ月	遮光・ 気密容器	変化なし	1)		
	項目		保存条件	保存期間	保存形態	結果																							
固 体 状 態	長期保存試験	室温	39ヶ月	遮光・ 気密容器	変化なし																								
	過酷試験	50℃	6ヶ月	遮光・ 気密容器	わずかに着色したが 安定であった。																								
		40℃ 75%RH	6ヶ月	遮光・ 気密容器	変化なし																								
	<table border="1"> <tr> <td>項目</td> <td>保存条件</td> <td>保存期間</td> <td>保存形態</td> <td>結果</td> </tr> <tr> <td>長期保存試験</td> <td>室温</td> <td>39ヵ月</td> <td>遮光 気密容器</td> <td>変化なし（規格範囲内）</td> </tr> <tr> <td rowspan="3">苛酷試験</td> <td>50℃</td> <td>6ヵ月</td> <td>遮光 気密容器</td> <td>変化なし（規格範囲内）</td> </tr> <tr> <td>40℃ 75%RH</td> <td>6ヵ月</td> <td>遮光 開放容器</td> <td>変化なし（規格範囲内）</td> </tr> <tr> <td>40℃ 93%RH</td> <td>6ヵ月</td> <td>遮光 開放容器</td> <td>変化なし（規格範囲内）</td> </tr> </table>					項目	保存条件	保存期間	保存形態	結果	長期保存試験	室温	39ヵ月	遮光 気密容器	変化なし（規格範囲内）	苛酷試験	50℃	6ヵ月	遮光 気密容器	変化なし（規格範囲内）	40℃ 75%RH	6ヵ月	遮光 開放容器	変化なし（規格範囲内）	40℃ 93%RH	6ヵ月	遮光 開放容器	変化なし（規格範囲内）	2)
項目	保存条件	保存期間	保存形態	結果																									
長期保存試験	室温	39ヵ月	遮光 気密容器	変化なし（規格範囲内）																									
苛酷試験	50℃	6ヵ月	遮光 気密容器	変化なし（規格範囲内）																									
	40℃ 75%RH	6ヵ月	遮光 開放容器	変化なし（規格範囲内）																									
	40℃ 93%RH	6ヵ月	遮光 開放容器	変化なし（規格範囲内）																									
測定項目：性状、UV、IR、吸光度、溶状、TLC、乾燥減量、異性体比、含量																													
膜透過性	なし																												
BCS・Biowaiver option	なし																												
薬効分類	131 眼科用剤																												
規格単位	0.25%1mL																												

【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	ニプラジロール点眼液0.25%「ニットー」	東亜薬品	○	記載対象外		○*
2	ニプラジロール点眼液0.25%「サワイ」	沢井製薬	○			○
3	ニプラジロール点眼液0.25%「ニッテン」	ニッテン	○+			○
4	ニプラジロールPF点眼液0.25%「日点」	日本点眼薬研究所	○+			○
5	ニプラジロール点眼液0.25%「わかもと」	わかもと製薬	○			○

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。【4~5 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、外用剤は検討対象外である。【6 ページ】

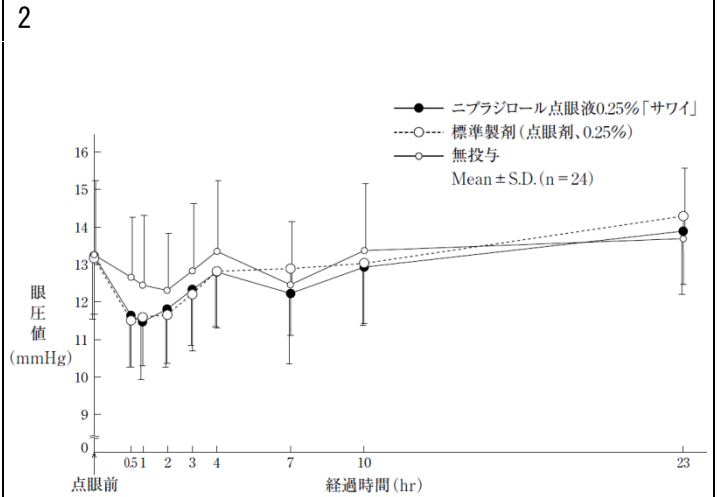
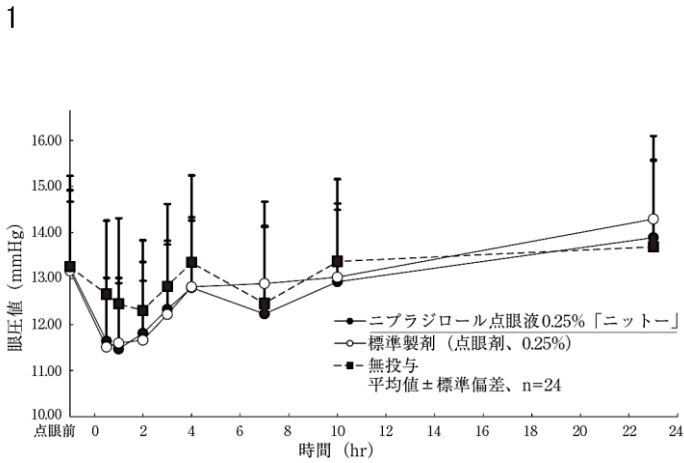
注)「純度」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での純度試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である(上記表中の番号は、本情報集に掲載された純度試験結果中の番号と対応している)。全品目で空欄となっている場合は、純度試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【7 ページ】

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】

注)東亜薬品及び沢井製薬の点眼液0.25%は、承認時において共同開発されたものである(医薬品審査管理課調査による)。

*: 旧販売名で記載

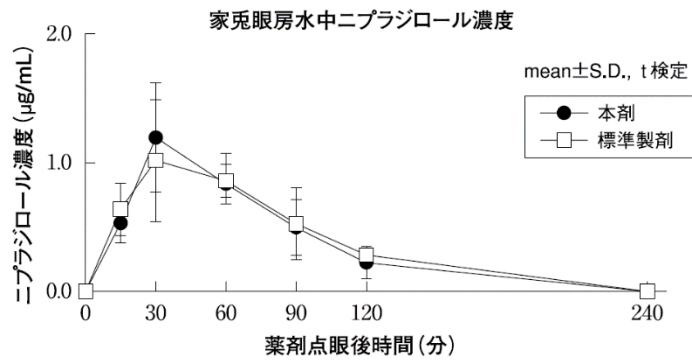
【生物学的同等性 (BE) 試験結果】



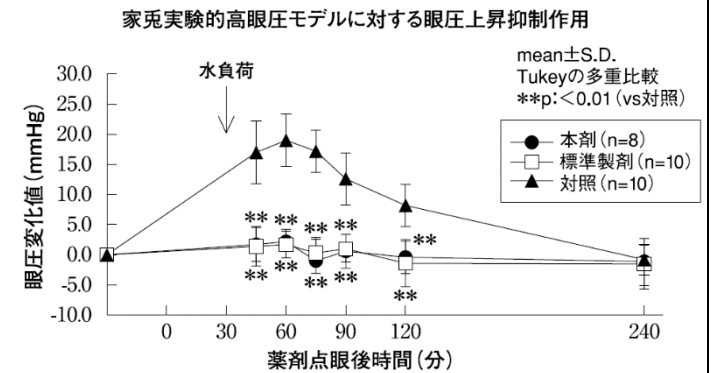
3 <参考>

ニブラジロール点眼液 0.25% 「ニッテン」

家兎眼房水移行性試験



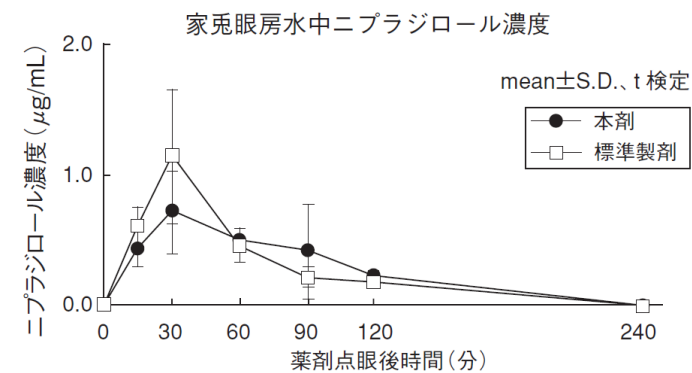
家兎実験的高眼圧モデルに対する効果



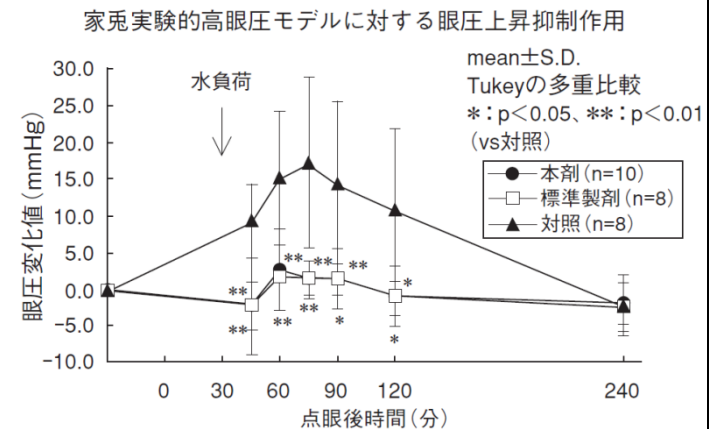
4 <参考>

ニブラジロール PF 点眼液 0.25% 「日点」

家兎眼房水移行性試験



家兎実験的高眼圧モデルに対する効果



ニブラジロール点眼液 0.25% 「わかもと」

本剤と標準製剤をクロスオーバー法により健康成人男子を対象として1回1滴ずつ両眼に点眼した。最低眼圧値及び眼圧値の時間曲線下面積（AUC）を同等性の指標とし、得られた値の平均値の差を90%信頼区間法にて統計解析を行った。その結果、同等性の判定基準80～120%の範囲内であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された。

	最低眼圧値 (mmHg)	AUC _{0→24} (mmHg・hr)
ニブラジロール点眼液 0.25% 「わかもと」	12.43±1.14	338.9±33.82
標準製剤(点眼液、0.25%)	12.32±1.35	336.9±31.03

(Mean±S.D.,n=12)

【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】³⁾

平成 29 年度（定量・力価試験） 適

【分析法（純度試験）】

なし

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) ニプラノール点眼液 0.25%（製造販売元：テイカ製薬株式会社）医薬品インタビューフォーム（2009年9月改訂、第7版）
- 2) ハイパジールコーワ点眼液 0.25%（製造販売元：興和株式会社）医薬品インタビューフォーム（2016年6月改訂、第10版）
- 3) 平成29年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成31年3月、厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課）