

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（2017. 9. 29 初版）

有効成分	スルファメトキサゾール・トリメトプリム		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	ダイフェン配合顆粒	鶴原製薬
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	バクタ配合顆粒	シオノギファーマ
	②	バクトラミン配合顆粒	太陽ファルマ
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⁾	【スルファメトキサゾール】 pKa : 5.60 【トリメトプリム】 pKa : 7.11		
溶解度 ¹⁾ (37°C)	【スルファメトキサゾール】 pH1.2 : 7.86mg/mL pH4.0 : 11.92mg/mL pH6.8 : 1.00mg/mL 水 : 0.56mg/mL 【トリメトプリム】 pH1.2 : 1.52mg/mL pH4.0 : 0.47mg/mL pH6.8 : 2.02mg/mL 水 : 0.45mg/mL		
原薬の安定性 ¹⁾	水	【スルファメトキサゾール】 なし 【トリメトプリム】 安定である。	
	液性(pH)	【スルファメトキサゾール】 酸性～塩基性領域で安定である。 【トリメトプリム】 酸性～塩基性領域で安定である。	
	光	【スルファメトキサゾール】 酸性溶液中では光に対して不安定である。 【トリメトプリム】 96%エタノール中、キセノンランプ下、6時間は安定である。	
	その他	なし	
膜透過性	なし		
BCS・Biowaiver option	なし		
薬効分類	629 その他の化学療法剤		
規格単位	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	ダイフェン配合顆粒	鶴原製薬	○	○*		

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。【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。【4~5 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注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。【6 ページ】

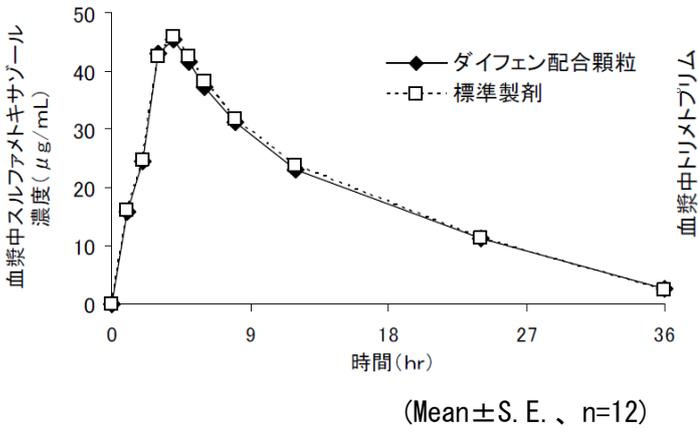
注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【7 ページ】

*：旧販売名で記載

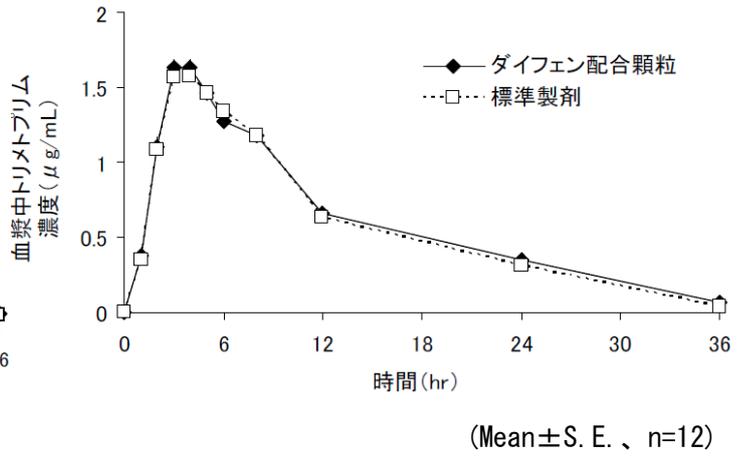
【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1

スルファメトキサゾール



トリメトプリム



※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

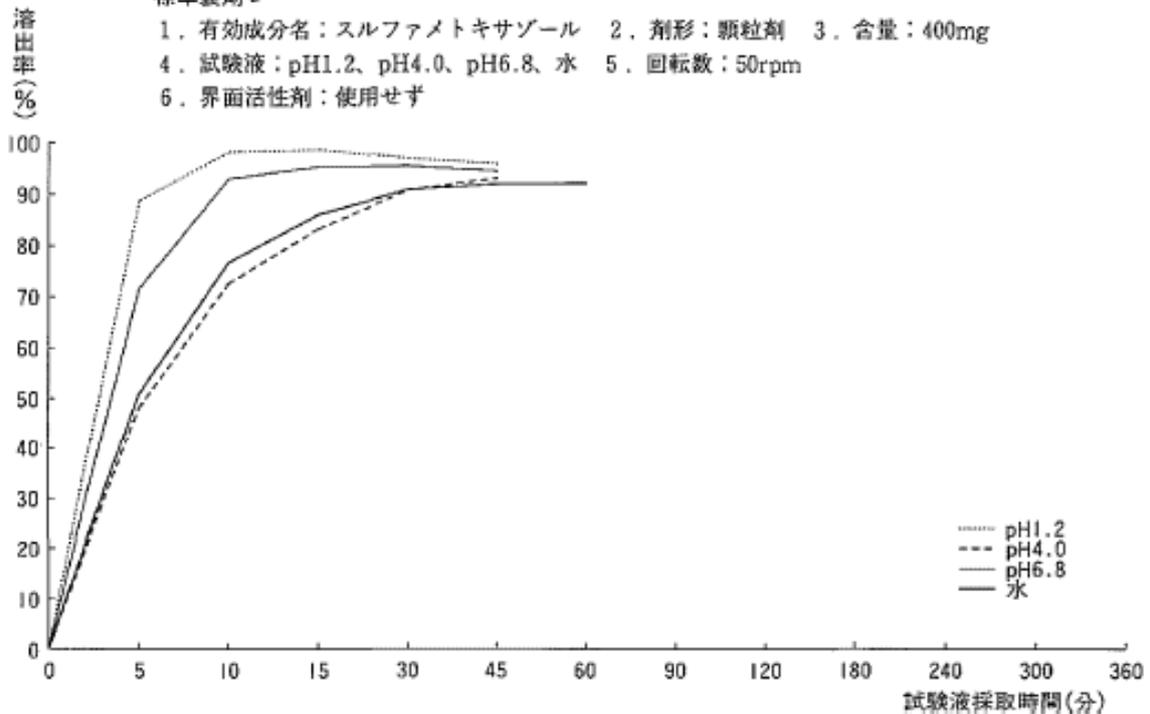
溶出曲線測定例

スルフィンソキサゾール・トリメトプリム顆粒

スルフィンソキサゾール400mg

標準製剤 a

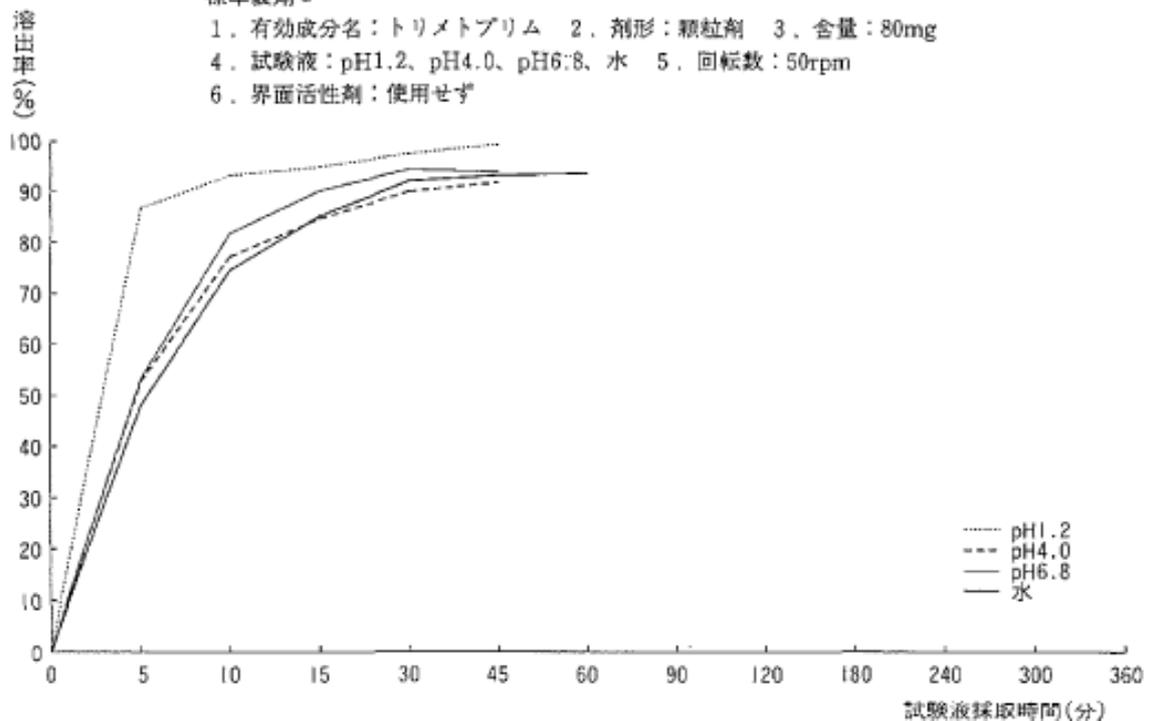
1. 有効成分名：スルファメトキサゾール
2. 剤形：顆粒剤
3. 含量：400mg
4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
5. 回転数：50rpm
6. 界面活性剤：使用せず



トリメトプリム80mg

標準製剤 a

1. 有効成分名：トリメトプリム
2. 剤形：顆粒剤
3. 含量：80mg
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



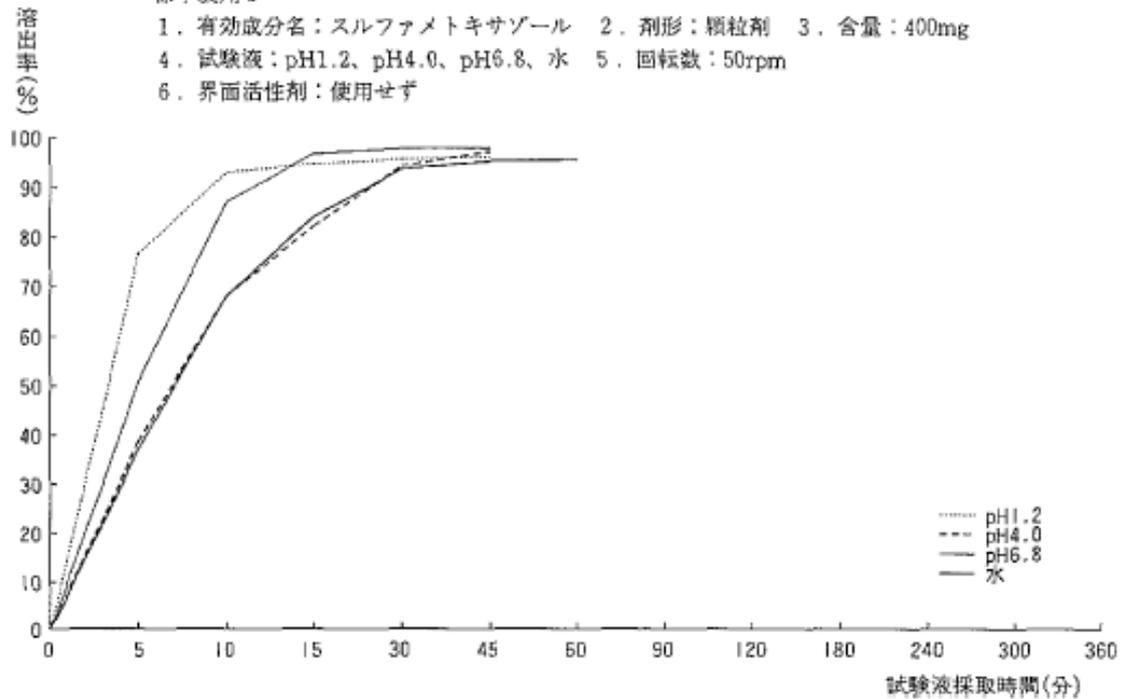
溶出曲線測定例

スルフィソキサゾール・トリメトプリム顆粒

スルフィソキサゾール400mg

標準製剤 b

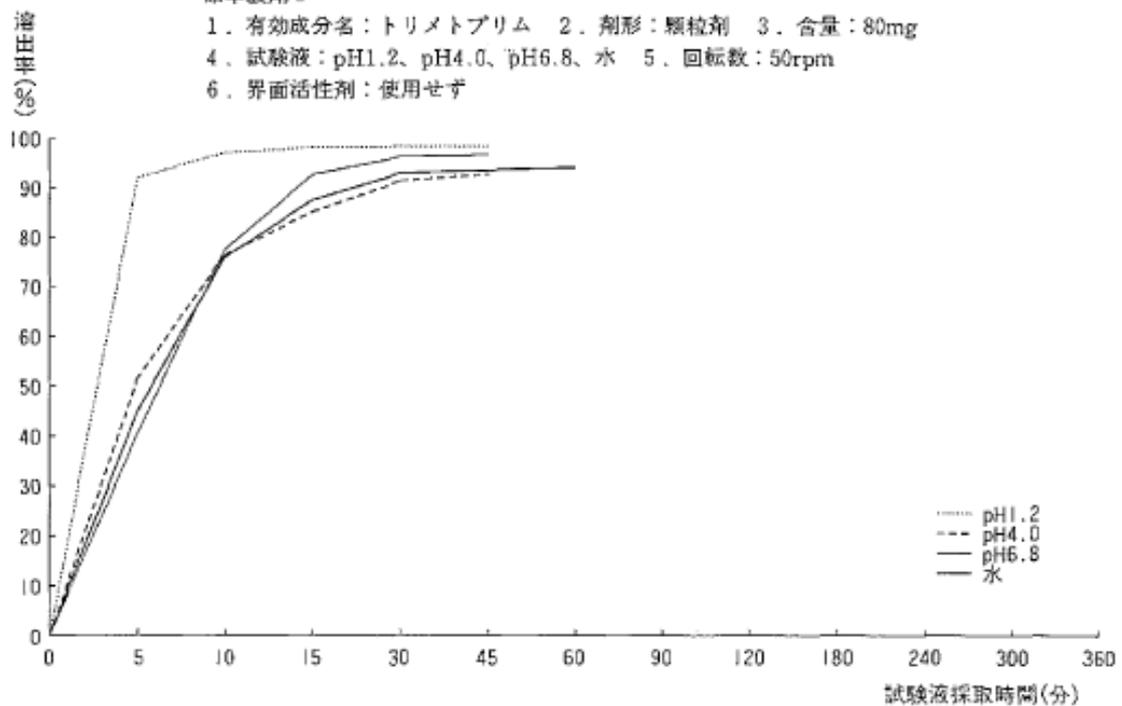
1. 有効成分名：スルファメトキサゾール
2. 剤形：顆粒剤
3. 含量：400mg
4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
5. 回転数：50rpm
6. 界面活性剤：使用せず



トリメトプリム80mg

標準製剤 b

1. 有効成分名：トリメトプリム
2. 剤形：顆粒剤
3. 含量：80mg
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】

なし

スルファメトキサゾール 400mg/g・トリメトプリム 80mg/g 顆粒
Sulfamethoxazole 400mg/g and Trimethoprim 80mg/g Granules

溶出試験 本品約 1g を精密に量り、試験液に薄めた pH6.8 のリン酸塩緩衝液(1→2)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、次のろ液を試料溶液とする。別にスルファメトキサゾール標準品を 105°C で 4 時間乾燥し、その約 0.022g を精密に量り、メタノールに溶かし、正確に 20mL とし、標準原液(1)とする。また、トリメトプリム標準品を 105°C で 5 時間乾燥し、その約 0.022g を精密に量り、メタノールに溶かし、正確に 50mL とし、標準原液(2)とする。標準原液(1)10mL 及び標準原液(2)5mL を正確に量り、薄めた pH6.8 のリン酸塩緩衝液(1→2)を加えて正確に 25mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 5 μ L ずつを正確にとり、次の条件で液体クロマトグラフ法により試験を行い、それぞれの液のスルファメトキサゾールのピーク面積 A_{Ta} 及び A_{Sa} 並びにトリメトプリムのピーク面積 A_{Tb} 及び A_{Sb} を測定する。本品が溶出規格を満たすときは適合とする。

スルファメトキサゾール ($C_{10}H_{11}N_3O_3S$) の表示量に対する溶出率(%)

$$= \frac{W_{Sa}}{W_T} \times \frac{A_{Ta}}{A_{Sa}} \times \frac{1}{C_a} \times 1800$$

トリメトプリム ($C_{14}H_{18}N_4O_3$) の表示量に対する溶出率(%)

$$= \frac{W_{Sb}}{W_T} \times \frac{A_{Tb}}{A_{Sb}} \times \frac{1}{C_b} \times 360$$

W_{Sa} : スルファメトキサゾール標準品の量 (mg)

W_{Sb} : トリメトプリム標準品の量 (mg)

W : スルファメトキサゾール・トリメトプリム顆粒の秤取量 (g)

C_a : 1g 中のスルファメトキサゾール ($C_{10}H_{11}N_3O_3S$) の表示量 (mg)

C_b : 1g 中のトリメトプリム ($C_{14}H_{18}N_4O_3$) の表示量 (mg)

試験条件

検出器 : 紫外吸光光度計(測定波長 : 254nm)

カラム : 内径 4.6mm, 長さ 15cm のステンレス管に 5 μ m の液体クロマトグラフ用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする。

カラム温度 : 25°C 付近の一定温度

移動相 : 水/アセトニトリル混液(7 : 2)900mL にトリエチルアミン 1.0mL を加えた液に薄めた酢酸(100)(1→100)を加え、pH5.9 に調整し、水を加えて 1000mL とする。

流量 : スルファメトキサゾールの保持時間が約 10 分になるように調整する。

システム適合性

システムの性能 : 標準溶液 5 μ L につき、上記の条件で操作するとき、トリメトプリム、スルファメトキサゾールの順に溶出し、その分離度は 8 以上である。

システムの再現性 : 標準溶液 5 μ L につき、上記の条件で試験を 6 回繰り返すとき、スルファメトキサゾール及びトリメトプリムのピーク面積の相対標準偏差はそれぞれ 2.0% 以下である。

溶出規格

	表示量	規定時間	溶出率
スルファメトキサゾール	400mg/g	15分	80%以上
トリメトプリム	80mg/g		80%以上

スルファメトキサゾール標準品 スルファメトキサゾール(日局).

トリメトプリム標準品 「トリメトプリム」. ただし, 乾燥したものを定量するとき, トリメトプリム ($C_{14}H_{18}N_4O_3$) 99.0%以上を含むもの.

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) 医療用医薬品品質情報（オレンジブック）（平成 15 年 10 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 15 年度（その 2）について（平成 15 年 9 月 25 日付け薬食発第 0925003 号、厚生労働省医薬食品局長通知）
- 3) 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 15 年 9 月 25 日付け薬食発第 0925006 号、厚生労働省医薬食品局長通知）