

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2017. 11. 30 初版

有効成分	トフィソパム		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	トフィソパム細粒 10%「CH」	長生堂製薬
	2	#トフィソパム細粒 10%「ツルハラ」	鶴原製薬
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	#グラндаキシン細粒 10%	持田製薬
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 : 10.3（ジアゼピン環、吸光度法）		
溶解度 <sup>1)</sup> (37°C)	pH1.2 : 8.747mg/mL pH3.0 : 0.142mg/mL pH6.8 : 0.027mg/mL 水 : 0.030mg/mL		
原薬の安定性 <sup>2)</sup>	水	なし	
	液性(pH)	なし	
	光	なし	
	その他	遮光して室温保存した場合、外観、におい、味及び TLC 試験において、3年後も変化を認めず安定であった。	
膜透過性	なし		
BCS・Biowaiver option	なし		
薬効分類	無印 : 112 催眠鎮静剤、抗不安剤 # : 123 自律神経剤		
規格単位	10% 1g		

【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	トフィソパム細粒10%「CH」	長生堂製薬	○	○*		
2	トフィソパム細粒10%「ツルハラ」	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<sup>3)</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】

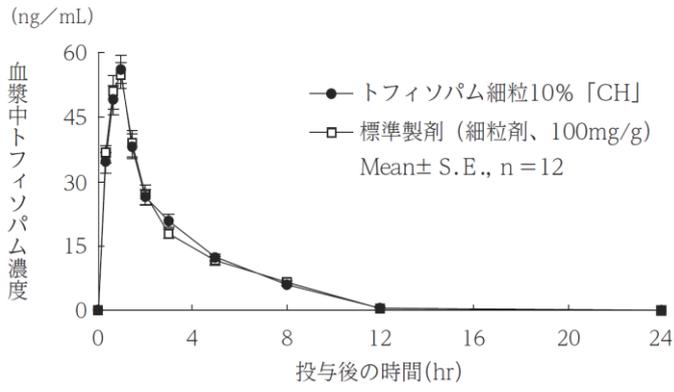
注)「溶出」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である(上記表中の番号は、本情報集に掲載された溶出試験結果中の番号と対応している)。全品目で空欄となっている場合は、溶出試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【5ページ】

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】

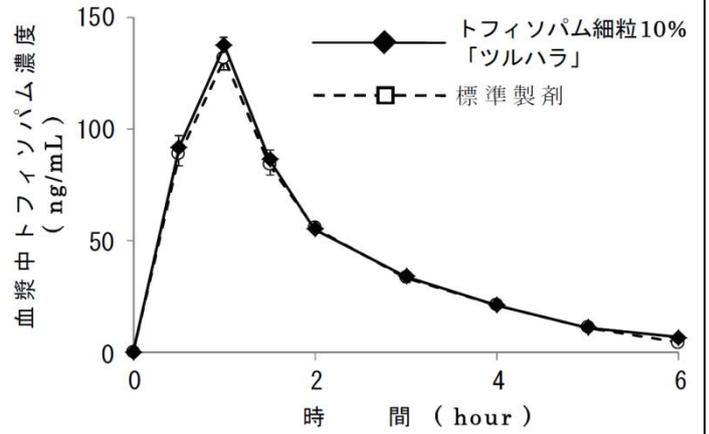
\*: 旧販売名で記載

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1



2



(Mean ± S.E., n=12)

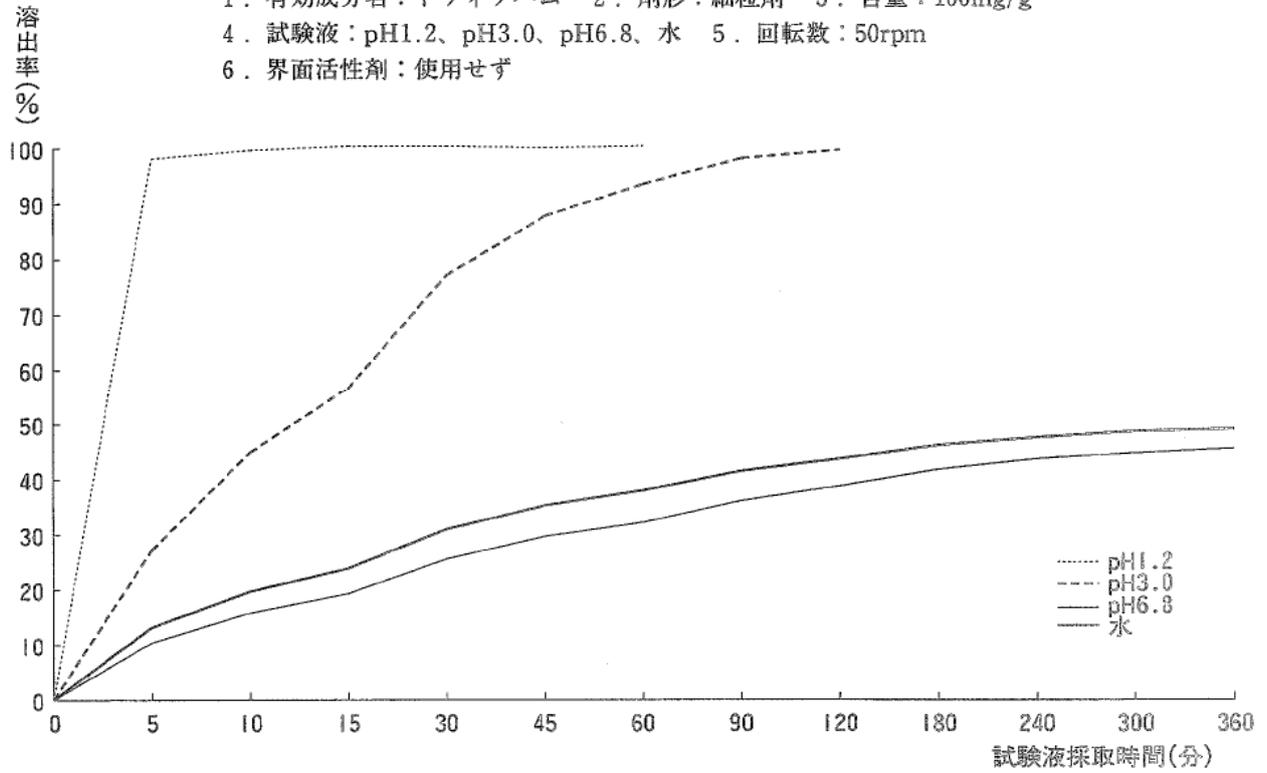
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】<sup>1)</sup>

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

トフィソパム細粒 10%

1. 有効成分名：トフィソパム
2. 剤形：細粒剤
3. 含量：100mg/g
4. 試験液：pH1.2、pH3.0、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

**トフィソパム細粒**  
**Tofisopam Fine Granules**

**溶出試験** 本品の表示量に従いトフィソパム(C<sub>22</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>)約0.05gに対応する量を精密に量り、試験液にpH3.0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0.45μm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、pH7.0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20mLとし、試料溶液とする。別にトフィソパム標準品をシリカゲルを乾燥剤として60°Cで3時間減圧乾燥し、その約0.028gを精密に量り、メタノールに溶かし、正確に100mLとする。この液4mLを正確に量り、pH7.0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100mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、pH7.0のリン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液を対照とし、紫外可視吸光度測定法により試験を行い、波長308nmにおける吸光度A<sub>T</sub>及びA<sub>S</sub>を測定する。

本品が溶出規格を満たすときは適合とする。

トフィソパム(C<sub>22</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>)の表示量に対する溶出率(%)

$$= \frac{W_S}{W_T} \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{1}{C} \times 180$$

W<sub>S</sub>: トフィソパム標準品の量(mg)

W<sub>T</sub>: トフィソパム細粒の秤取量(g)

C: 1g中のトフィソパム(C<sub>22</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>)の表示量(mg)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
100mg/g	60分	75%以上

**トフィソパム標準品** トフィソパム(日局)。ただし、乾燥したものを定量するとき、トフィソパム(C<sub>22</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>)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, pH3.0** クエン酸一水和物5.25gを水に溶して1000mLとした液に、0.05mol/Lリン酸水素二ナトリウム試液を加え、pH3.0に調整する。

**リン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液, pH7.0** 0.05mol/Lリン酸水素二ナトリウム試液1000mL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、pH7.0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（オレンジブック）（平成 15 年 3 月版、厚生労働省医薬局審査管理課）
- 2) グランダキシ錠 50／細粒 10%（製造販売元：持田製薬株式会社）医薬品インタビューフォーム（2017 年 10 月改訂、第 5 版）
- 3) 医療用医薬品再評価結果 平成 14 年度（その 3）について（平成 15 年 2 月 21 日付け医薬発第 0221001 号、厚生労働省医薬局長通知）
- 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 15 年 2 月 21 日付け医薬発第 0221005 号、厚生労働省医薬局長通知）