

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2018. 4. 25 初版

有効成分	イマチニブメシル酸塩		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	イマチニブ錠 100mg 「EE」	エルメッド エーザイ
	2	イマチニブ錠 100mg 「KN」	小林化工
	3	イマチニブ錠 100mg 「NK」	日本化薬
	4	イマチニブ錠 100mg 「ヤクルト」	高田製薬
	5	イマチニブ錠 100mg 「DSEP」	第一三共エスファ
	6	イマチニブ錠 100mg 「NSKK」	共創未来ファーマ
	7	イマチニブ錠 100mg 「ニプロ」	ニプロ
	8	イマチニブ錠 100mg 「明治」	Meiji Seika ファルマ
	9	イマチニブ錠 100mg 「オーハラ」	大原薬品工業
	10	イマチニブ錠 100mg 「ケミファ」	日本ケミファ
	11	イマチニブ錠 100mg 「サワイ」	沢井製薬
	12	イマチニブ錠 100mg 「JG」	日本ジェネリック
	13	イマチニブ錠 100mg 「TCK」	辰巳化学
	14	イマチニブ錠 100mg 「トーワ」	東和薬品
	15	イマチニブ錠 100mg 「日医工」	日医工
	16	イマチニブ錠 100mg 「ファイザー」	マイラン製薬
	17	イマチニブ錠 100mg 「テバ」	武田テバファーマ
	18	イマチニブ錠 200mg 「ニプロ」	ニプロ
	19	イマチニブ錠 200mg 「明治」	Meiji Seika ファルマ
	20	イマチニブ錠 200mg 「ヤクルト」	高田製薬
	21	イマチニブ錠 200mg 「トーワ」	東和薬品
	22	イマチニブ錠 200mg 「日医工」	日医工
	23	イマチニブ錠 200mg 「サワイ」	沢井製薬
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	グリベック錠 100mg	ノバルティス ファーマ
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⁾	pK _{a1} =7.8、pK _{a2} =3.8、pK _{a3} =3.3 (溶媒：1,4-ジオキサン/ 水混液)		

溶解度 ¹⁾ (23~25℃)		<p>水に極めて溶けやすい。 溶解度に pH 依存性があり、酸性側では溶けやすいが、pH が 5.5 より大きくなると溶けにくくなる。</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>溶媒名</th> <th>溶解度 (W/V%)</th> <th>日本薬局方の表現</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>水</td> <td>130</td> <td>極めて溶けやすい</td> </tr> <tr> <td>リン酸塩緩衝液 pH5.5</td> <td>≥10</td> <td>やや溶けやすい</td> </tr> <tr> <td>リン酸塩緩衝液 pH6.0</td> <td>0.1</td> <td>溶けにくい</td> </tr> <tr> <td>リン酸塩緩衝液 pH8.0</td> <td><0.001</td> <td>ほとんど溶けない</td> </tr> </tbody> </table>					溶媒名	溶解度 (W/V%)	日本薬局方の表現	水	130	極めて溶けやすい	リン酸塩緩衝液 pH5.5	≥10	やや溶けやすい	リン酸塩緩衝液 pH6.0	0.1	溶けにくい	リン酸塩緩衝液 pH8.0	<0.001	ほとんど溶けない													
溶媒名	溶解度 (W/V%)	日本薬局方の表現																																
水	130	極めて溶けやすい																																
リン酸塩緩衝液 pH5.5	≥10	やや溶けやすい																																
リン酸塩緩衝液 pH6.0	0.1	溶けにくい																																
リン酸塩緩衝液 pH8.0	<0.001	ほとんど溶けない																																
原薬の安定性 ¹⁾	水	なし																																
	液性 (pH)	なし																																
	光	<table border="1"> <thead> <tr> <th></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>苛酷試験</td> <td>キセノンランプ照射下</td> <td>120 万 Lux・hr</td> <td>シャーレ (石英板でカバー)</td> <td>わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。</td> </tr> </tbody> </table>					保存条件	保存期間	保存形態	結果	苛酷試験	キセノンランプ照射下	120 万 Lux・hr	シャーレ (石英板でカバー)	わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。	測定項目 : 外観、確認試験、類縁物質、水分、含量等																		
			保存条件	保存期間	保存形態	結果																												
苛酷試験	キセノンランプ照射下	120 万 Lux・hr	シャーレ (石英板でカバー)	わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。																														
その他	<table border="1"> <thead> <tr> <th></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>長期保存試験</td> <td>25℃ 60% RH</td> <td>36 カ月</td> <td>ポリエチレン袋</td> <td>わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。</td> </tr> <tr> <td rowspan="2">加速試験</td> <td>40℃ 75% RH</td> <td>6 カ月</td> <td>ポリエチレン袋 褐色ガラス瓶</td> <td rowspan="2">わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。</td> </tr> <tr> <td>30℃ 60% RH</td> <td>12 カ月</td> <td>ポリエチレン袋 褐色ガラス瓶</td> </tr> <tr> <td rowspan="4">苛酷試験</td> <td>50℃ 30% RH 以下</td> <td rowspan="4">1 カ月</td> <td>無包装 ポリエチレン袋</td> <td rowspan="4">わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。</td> </tr> <tr> <td>50℃ 75% RH</td> <td>無包装 ポリエチレン袋</td> </tr> <tr> <td>60℃ 30% RH 以下</td> <td>無包装</td> </tr> <tr> <td>60℃ 75% RH</td> <td>無包装 ポリエチレン袋</td> </tr> </tbody> </table>					保存条件	保存期間	保存形態	結果	長期保存試験	25℃ 60% RH	36 カ月	ポリエチレン袋	わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。	加速試験	40℃ 75% RH	6 カ月	ポリエチレン袋 褐色ガラス瓶	わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。	30℃ 60% RH	12 カ月	ポリエチレン袋 褐色ガラス瓶	苛酷試験	50℃ 30% RH 以下	1 カ月	無包装 ポリエチレン袋	わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。	50℃ 75% RH	無包装 ポリエチレン袋	60℃ 30% RH 以下	無包装	60℃ 75% RH	無包装 ポリエチレン袋	測定項目 : 外観、確認試験、類縁物質、水分、含量等
	保存条件	保存期間	保存形態	結果																														
長期保存試験	25℃ 60% RH	36 カ月	ポリエチレン袋	わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。																														
加速試験	40℃ 75% RH	6 カ月	ポリエチレン袋 褐色ガラス瓶	わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。																														
	30℃ 60% RH	12 カ月	ポリエチレン袋 褐色ガラス瓶																															
苛酷試験	50℃ 30% RH 以下	1 カ月	無包装 ポリエチレン袋	わずかな類縁物質の増加を認めたが、その他の変化は認めなかった。																														
	50℃ 75% RH		無包装 ポリエチレン袋																															
	60℃ 30% RH 以下		無包装																															
	60℃ 75% RH		無包装 ポリエチレン袋																															
膜透過性	なし																																	
BCS・Biowaiver option	なし																																	
薬効分類	429 その他の腫瘍用薬																																	
規格単位	100mg 1錠 200mg 1錠																																	

【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	イマチニブ錠100mg「EE」	エルメッド エーザイ	○			
2	イマチニブ錠100mg「KN」	小林化工	○			
3	イマチニブ錠100mg「NK」	日本化薬	○			
4	イマチニブ錠100mg「ヤクルト」	高田製薬	○			
5	イマチニブ錠100mg「DSEP」	第一三共エスファ	○			
6	イマチニブ錠100mg「NSKK」	共創未来ファーマ	○			
7	イマチニブ錠100mg「ニプロ」	ニプロ	○			
8	イマチニブ錠100mg「明治」	Meiji Seika ファルマ	○			
9	イマチニブ錠100mg「オーハラ」	大原薬品工業	○			
10	イマチニブ錠100mg「ケミファ」	日本ケミファ	○			
11	イマチニブ錠100mg「サワイ」	沢井製薬	○			
12	イマチニブ錠100mg「JG」	日本ジェネリック	○			
13	イマチニブ錠100mg「TCK」	辰巳化学	○			
14	イマチニブ錠100mg「トーワ」	東和薬品	○			
15	イマチニブ錠100mg「日医工」	日医工	○			
16	イマチニブ錠100mg「ファイザー」	マイラン製薬	○			
17	イマチニブ錠100mg「テバ」	武田テバファーマ	○			
18	イマチニブ錠200mg「ニプロ」	ニプロ	○			
19	イマチニブ錠200mg「明治」	Meiji Seika ファルマ	○			
20	イマチニブ錠200mg「ヤクルト」	高田製薬	○			
21	イマチニブ錠200mg「トーワ」	東和薬品	○			
22	イマチニブ錠200mg「日医工」	日医工	○			
23	イマチニブ錠200mg「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。【5~9 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。【10 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。【11 ページ】

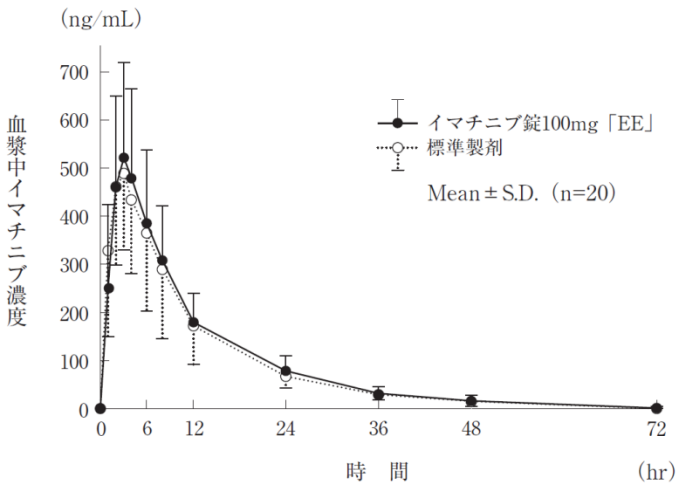
注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【12 ページ】

注) エルメッド エーザイ、小林化工、第一三共エスファ、共創未来ファーマ、ニプロ、Meiji Seika ファルマ、

大原薬品工業、日本ケミファ、日本ジェネリック、辰巳化学、東和薬品、日医工及びマイラン製薬の錠 100mg は、承認時において他社と共同開発されたものである。ニプロ、Meiji Seika ファルマ、東和薬品及び日医工の錠 200mg は、承認時において他社と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）。

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1



1 錠投与時の平均血漿中薬物濃度推移

2

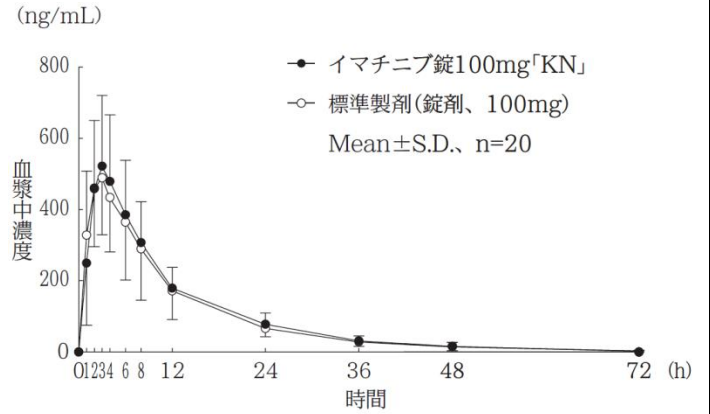
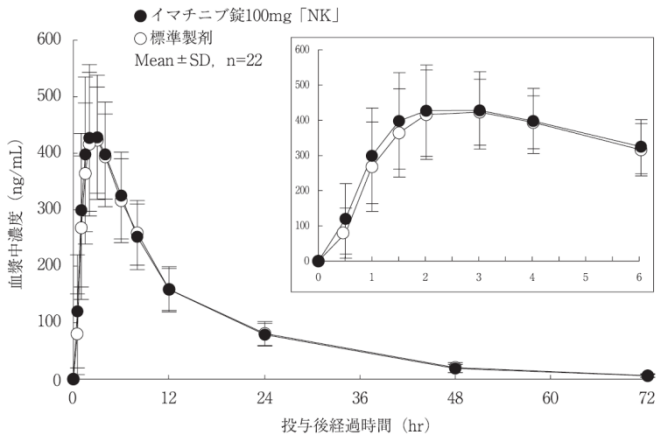


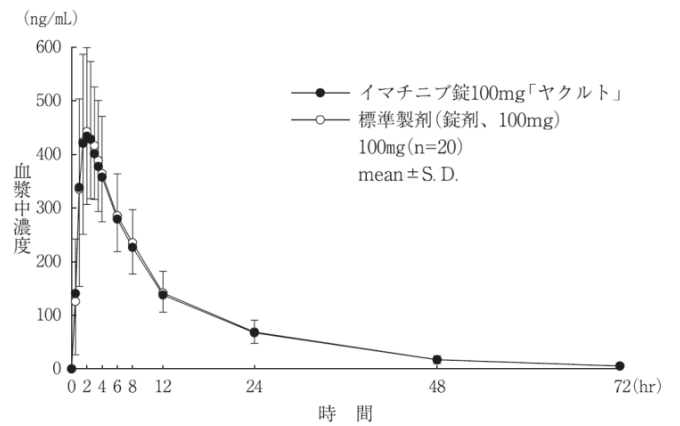
図 イマチニブの血漿中濃度推移

3

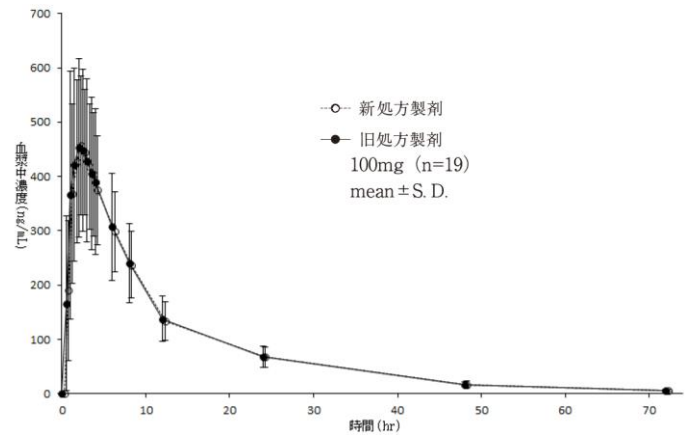


4

(旧処方製剤)



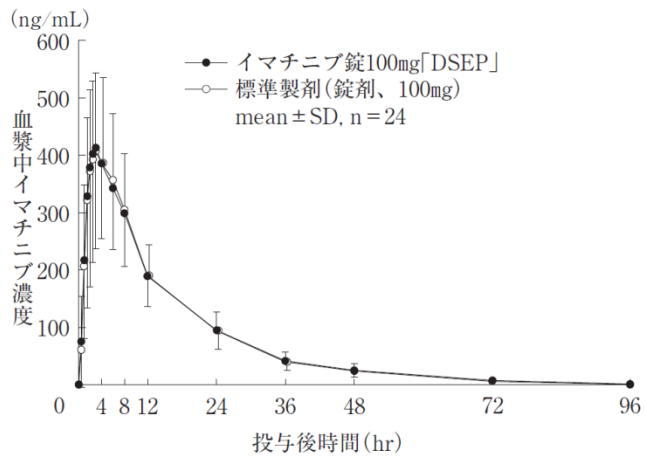
(新処方製剤)



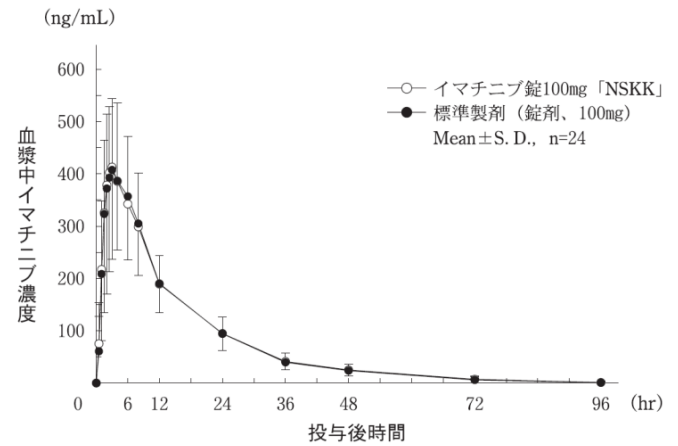
(社内資料より)

5

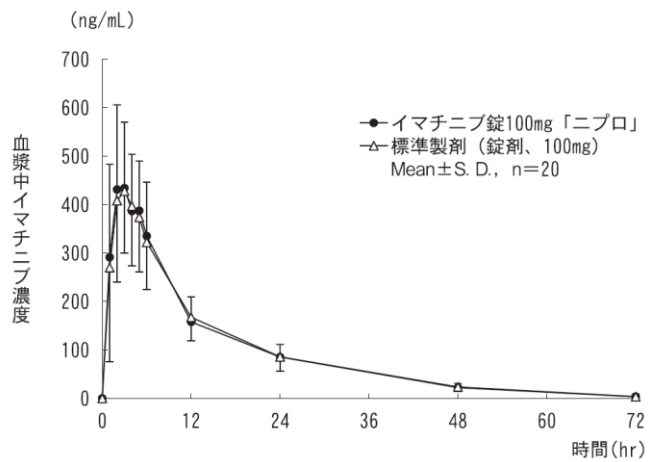
血漿中イマチニブ濃度の推移



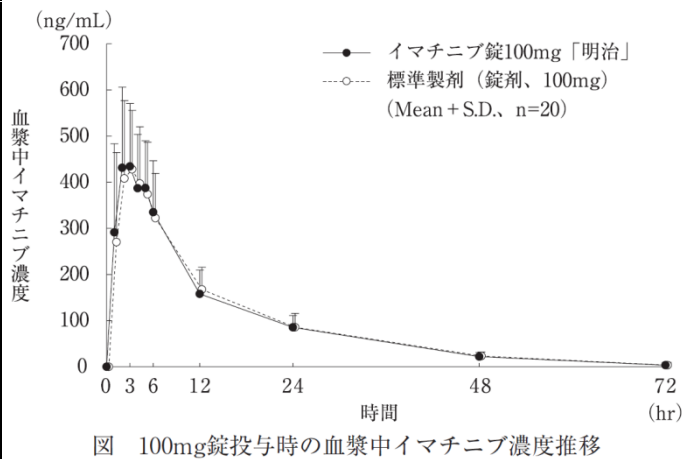
6



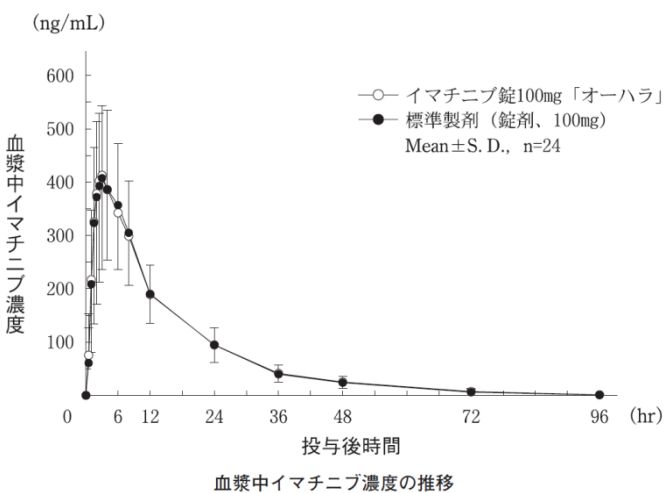
7



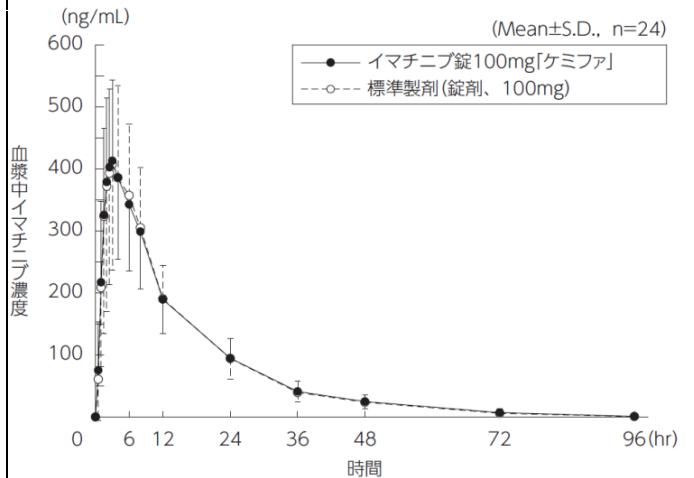
8



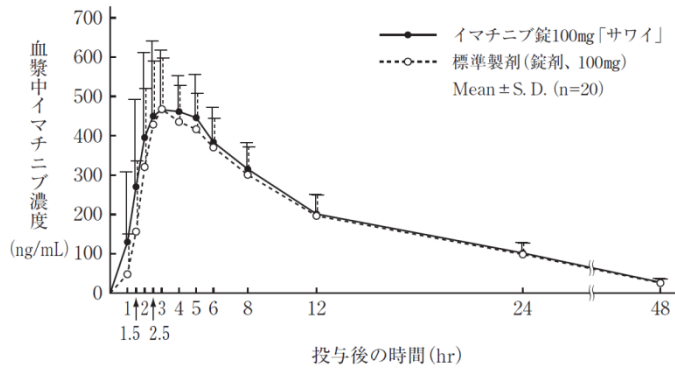
9



10

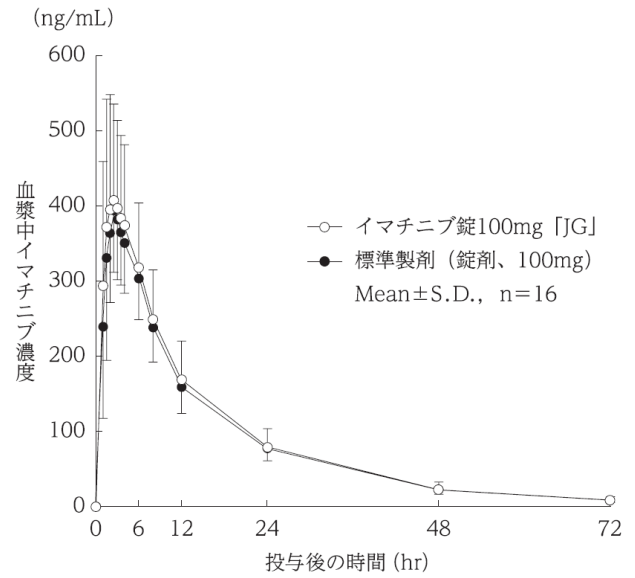


11

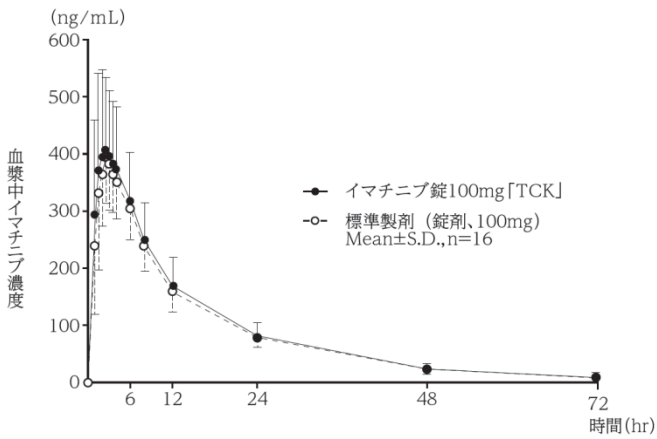


※ イマチニブ錠 100mg「サワイ」及び標準製剤は各1錠投与。

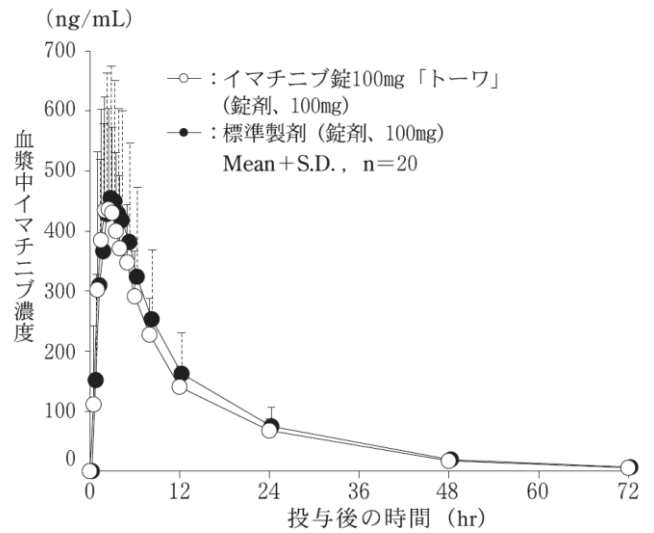
12



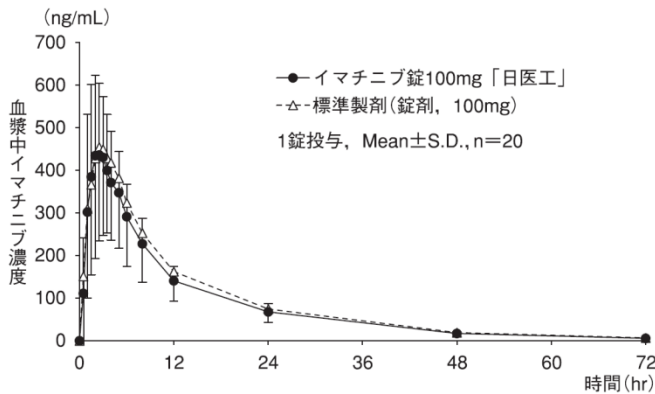
13



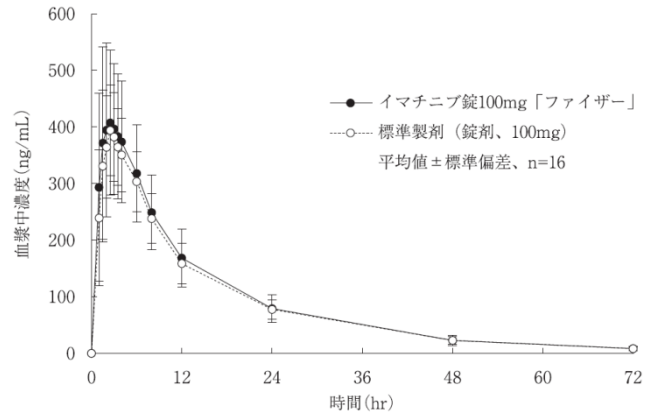
14



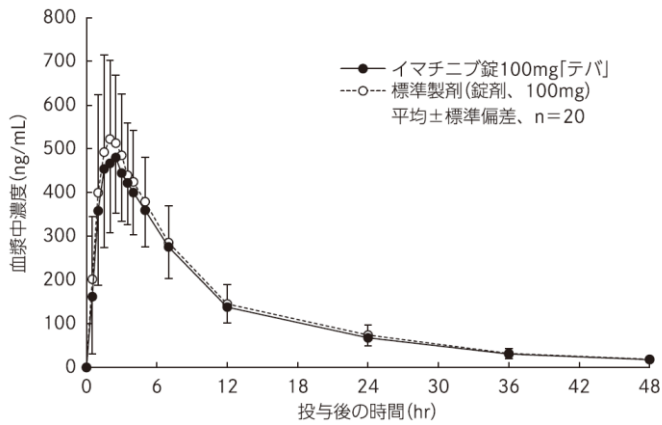
15



16



17



18

イマチニブ錠 200mg「ニプロ」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、イマチニブ錠 100mg「ニプロ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

19

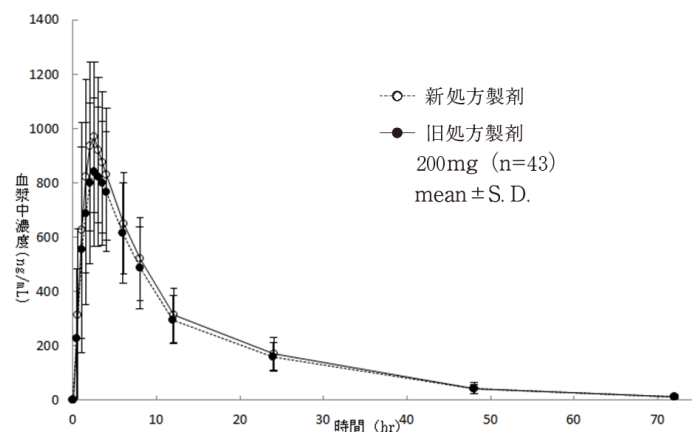
イマチニブ錠 200mg「明治」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、イマチニブ錠 100mg「明治」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

20

イマチニブ錠 200mg「ヤクルト」
 (旧処方製剤)

本剤はイマチニブ錠 100mg「ヤクルト」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日一部改正薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、イマチニブ錠 100mg「ヤクルト」と溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

(新処方製剤)



(社内資料より)

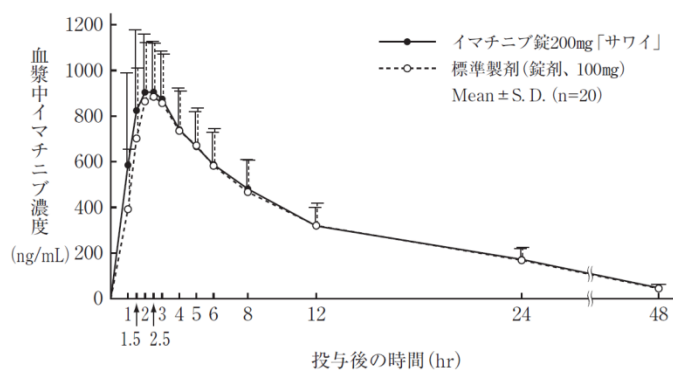
21

イマチニブ錠 200 mg「トーワ」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、イマチニブ錠 100 mg「トーワ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

22

イマチニブ錠 200mg「日医工」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、イマチニブ錠 100mg「日医工」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

23



※ イマチニブ錠 100mg「サワイ」は1錠、標準製剤は2錠投与。

【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】

なし

【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

【分析法（溶出試験）】

なし

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) グリベック錠 100mg（製造販売元：ノバルティス ファーマ株式会社）医薬品インタビューフォーム（2017年7月改訂、第12版）