

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	ペミロラストカリウム		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	ペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」	マイラン製薬
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	ペミラストンドライシロップ0.5%	アルフレッサファーマ
	②	アレギサールドライシロップ0.5%	ニプロES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⁾ （室温）	pKa：5.0（テトラゾール基、吸光度法）		
溶解度 ¹⁾ （37℃）	<p>pH1.2： 8.3×10⁻³mg/mL</p> <p>pH5.0： 0.16 mg/mL</p> <p>pH6.8： 8.9 mg/mL</p> <p>水： 310 mg/mL</p>		
原薬の安定性 ¹⁾	水	なし	
	液性（pH）	pH11.0以上で分解する。	
	光	なし	
	その他	なし	
膜透過性	なし		
BCS・Biowaiver option	なし		
薬効分類	449 その他のアレルギー用薬		
規格単位	0.5% 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	ペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」	マイラン製薬	○			○

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】

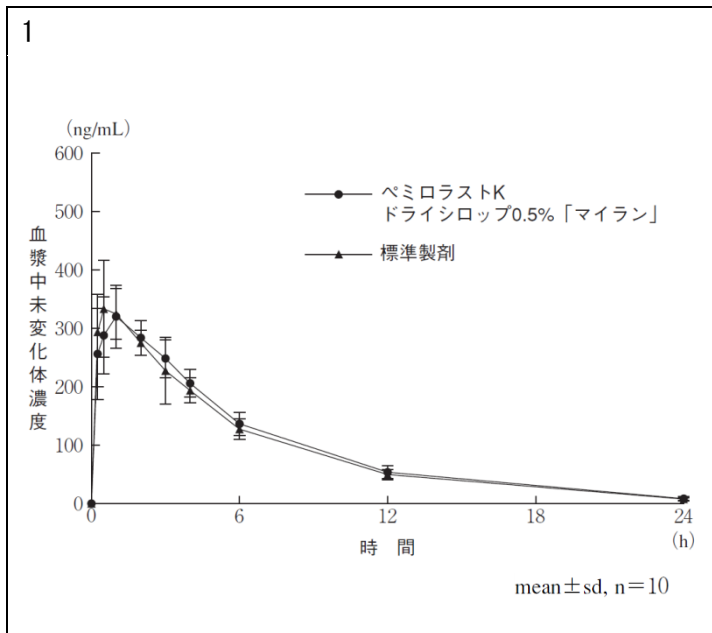
注)「溶出」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である (上記表中の番号は、本情報集に掲載された溶出試験結果中の番号と対応している)。全品目で空欄となっている場合は、溶出試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【5 ページ】

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】

注) マイラン製薬の製剤は、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)。

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1



【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

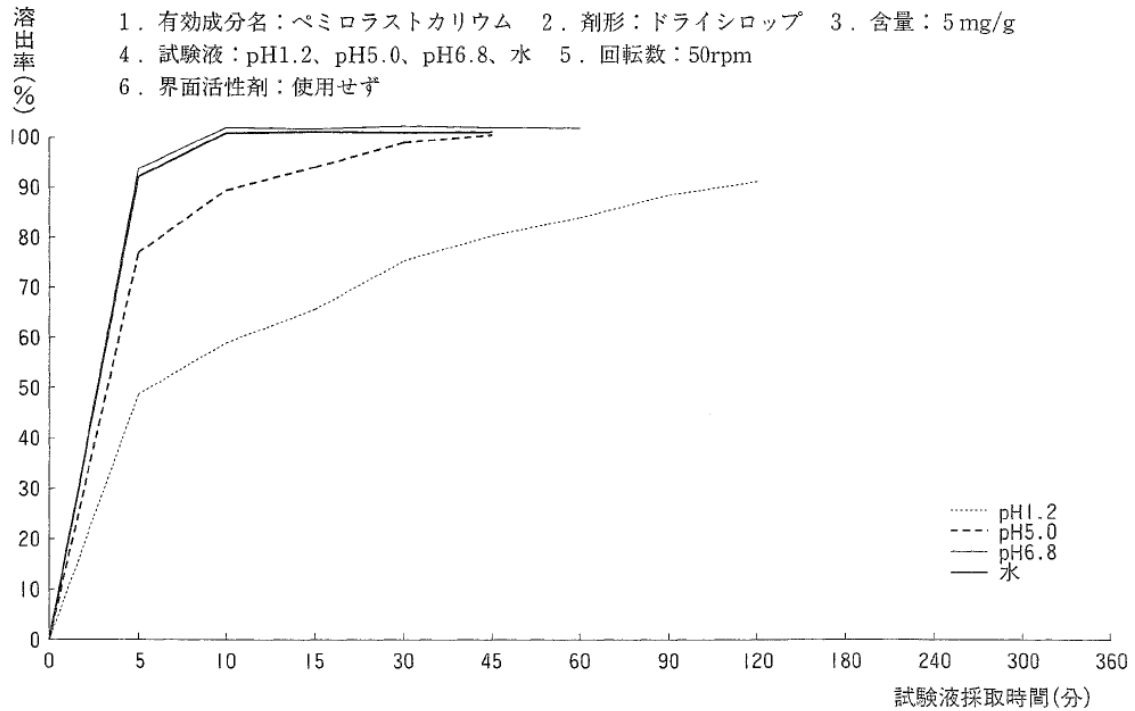
溶出曲線測定例

ペミロラストカリウムシロップ用0.5%

ペミラストンドライシロップ0.5%

標準製剤 a

1. 有効成分名：ペミロラストカリウム
2. 剤形：ドライシロップ
3. 含量：5 mg/g
4. 試験液：pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
5. 回転数：50rpm
6. 界面活性剤：使用せず



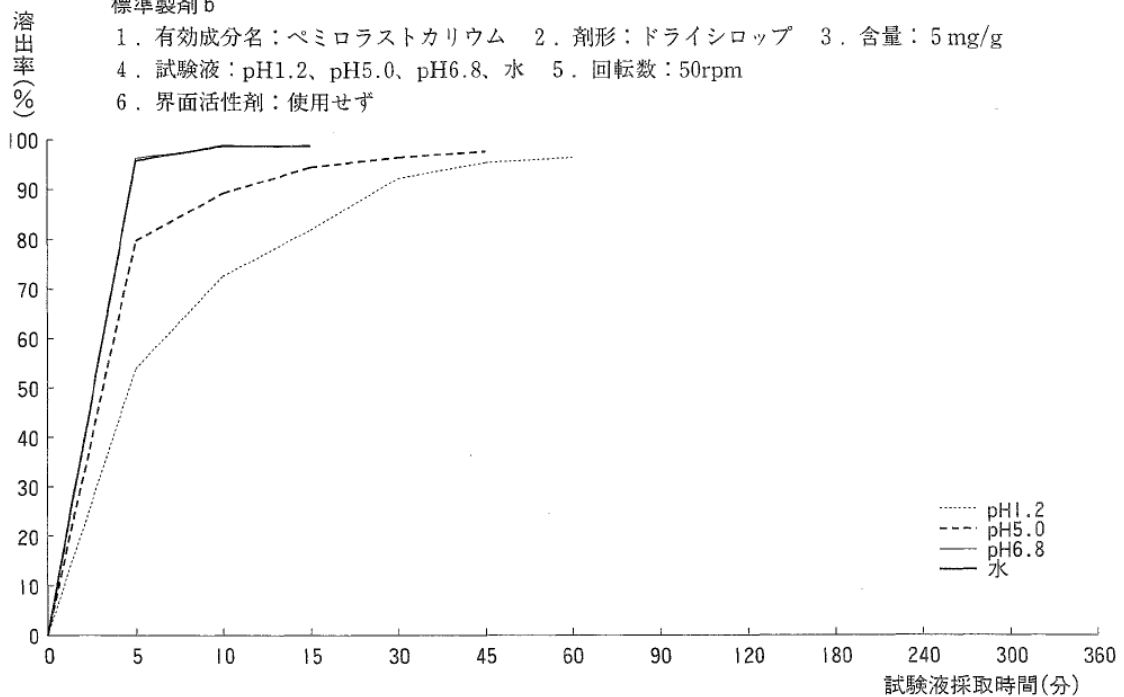
溶出曲線測定例

ペミロラストカリウムシロップ用0.5%

アレキサールドライシロップ0.5%

標準製剤 b

1. 有効成分名：ペミロラストカリウム
2. 剤形：ドライシロップ
3. 含量：5 mg/g
4. 試験液：pH1.2、pH5.0、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】²⁾

平成 29 年度（溶出試験） 適

ペミロラストカリウムドライシロップ

Pemirolast Potassium Dry Syrup

溶出試験 本品の表示量に従いペミロラストカリウム(C₁₀H₇KN₆O)約5mgに対応する量を精密に量り、試験液にpH5.0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、薄めた水酸化カリウム試液(1→10)2mLを正確に加え、試料溶液とする。別にペミロラストカリウム標準品(別途本品0.1gにつき、水分測定法の電量滴定法により水分を測定しておく)約0.028gを精密に量り、水に溶かし、正確に100mLとする。この液5mLを正確に量り、水を加えて正確に50mLとする。更にこの液5mLを正確に量り、水を加えて正確に25mLとする。この液4mLを正確に量り、薄めた水酸化カリウム試液(1→10)2mLを正確に加え、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、水を対照とし、紫外可視吸光度測定法により試験を行い、波長357nmにおける吸光度A_t及びA_sを測定する。

本品が溶出規格を満たすときは適合とする。

ペミロラストカリウム(C₁₀H₇KN₆O)の表示量に対する溶出率(%)

$$= \frac{W_S}{W_T} \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{1}{C} \times 18$$

W_S: 脱水物に換算したペミロラストカリウム標準品の量(mg)

W_T: ペミロラストカリウムドライシロップの秤取量(g)

C: 1g中のペミロラストカリウム(C₁₀H₇KN₆O)の表示量(mg)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
5mg/g	15分	80%以上

ペミロラストカリウム標準品 C₁₀H₇KN₆O: 266.30 9-メチル-3-(1*H*-テトラゾール-5-イル)-4*H*-ピリド[1,2-*a*]ピリミジン-4-オンカリウム塩で、下記の規格に適合するもの。必要な場合には次に示す方法により精製する。

精製法 ペミロラストカリウム3gを水20mLに加熱して溶かし、混時ろ過し、ろ液を2-プロパノール200mL中に滴加する。析出した結晶をろ取し、2-プロパノール100mLで洗浄後、105℃で3時間乾燥する。

性状 本品は淡黄色の粉末である。

確認試験 本品を105℃で3時間乾燥し、赤外吸収スペクトル測定法の臭化カリウム錠剤法により測定するとき、波数3080cm⁻¹、1690cm⁻¹、1310cm⁻¹及び785cm⁻¹付近に吸収を認める。

類縁物質 本品0.10gをメタノール20mLに溶かし、試料溶液とする。この液1mLを正確に量り、メタノールを加えて正確に100mLとする。この液1mLを正確に量り、メタノールを加えて正確に20mLとし、標準溶液とする。これらの液につき、薄層クロマトグラフ法により試験を行う。試料溶液及び標準溶液20μLずつを、薄層クロマトグラフ用シリカゲル(蛍光剤入り)を用いて調製した薄層板にスポットする。次にメタノール/1,4-ジオキサン/アンモニア水(28)混液(5:5:2)を展開溶媒として約10cm展開した後、薄層板を風乾する。これに紫外線(主波長254nm)を照射するとき、試料溶液から得た主スポット以外のスポット

は、標準溶液から得たスポットより濃くない。

水分 0.5%以下(0.1g, 電量滴定法)。

含量 換算した脱水物に対し99.0%以上. 定量法 本品約0.2gを精密に量り, 水150mLに溶かし, 0.1mol/L塩酸で滴定する(電位差滴定法)。同様の方法で空試験を行い, 補正する。

0.1mol/L 塩酸 1ml=26.630mg $C_{10}H_7KN_6O$

リン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液, pH5.0 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, pH5.0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集（オレンジブック）（平成 14 年 7 月版、厚生労働省医薬局審査管理課）
- 2) 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）
- 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 14 年 7 月 10 日付け医薬発第 0710005 号、厚生労働省医薬局長通知）