

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2023.03.23 初版

有効成分	ピコスルファートナトリウム水和物	
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	ピコスルファートナトリウム顆粒1%「ゼリア」 日新製薬（山形）
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	なし
効能・効果	https://www.bbdb.jp	
用法・用量	https://www.bbdb.jp	
添加物	https://www.bbdb.jp	
解離定数 ¹⁾ （常温）	pKa：5.32（スルホン酸基、分光光度法） pKa：5.50（スルホン酸基、滴定法）	
溶解度 ¹⁾ （37℃）	pH1.2：848mg/mL pH4.0：863mg/mL pH6.8：856mg/mL 水：849mg/mL	
原薬の安定性 ¹⁾	水	なし
	液性（pH）	pH1.2、37℃、24時間で約29%分解する。 pH4.0付近では45℃以下で比較的安定である。 pH7.0以上のアルカリ性で極めて安定である。
	光	なし
	その他	なし
膜透過性	なし	
BCS・Biowaiver option	なし	
薬効分類	235 下剤、浣腸剤	
規格単位	1% 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	ピコスルファートナトリウム顆粒1%「ゼリア」	日新製薬（山形）	○+	○*		○*

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。【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 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】

【生物学的同等性（BE）試験結果】

1 <参考>

ラット1群10匹に、ピコスルファートナトリウム顆粒1%「ゼリア」と対照製剤を、ピコスルファートナトリウム水和物としてそれぞれ1、3、4、5mg/kg 経口投与した後の下痢便秘排泄状態を観察し、50%瀉下有効量（ED50）を算出した結果、ピコスルファートナトリウム顆粒1%「ゼリア」では3.10mg/kg、対照製剤では3.22mg/kgであった。

また、用量—陽性率直線の平行線検定の結果、両製剤は効力比1.0で有意な平行性が認められ、両製剤の生物学的同等性が確認された。

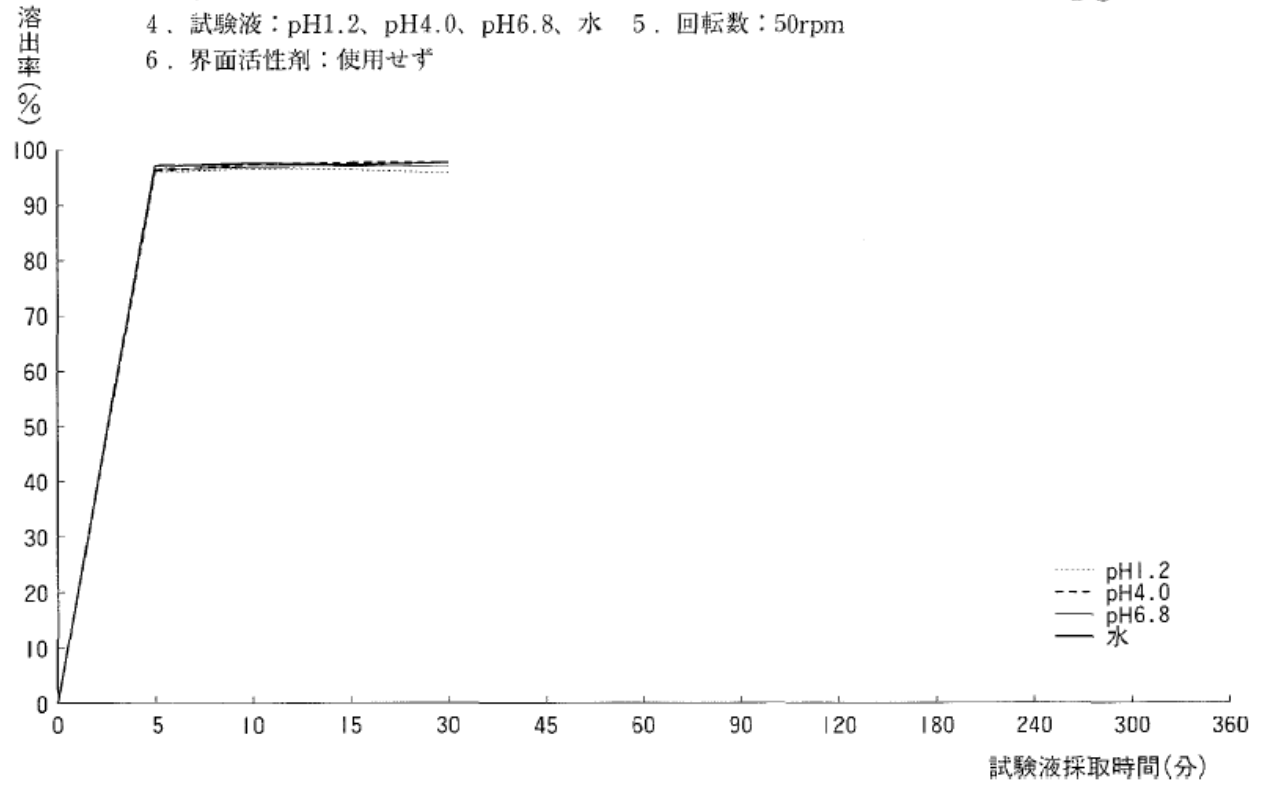
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

ピコスルファートナトリウム顆粒1%

1. 有効成分名：ピコスルファートナトリウム 2. 剤形：顆粒剤 3. 含量：10mg/g
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】³⁾

平成 23 年度（溶出試験） 適

ピコスルファートナトリウム顆粒

Sodium Picosulfate Granules

溶出試験 本品の表示量に従いピコスルファートナトリウム ($C_{18}H_{13}NNa_2O_8S_2 \cdot H_2O$) 約 7.5mg に対応する量を精密に量り、試験液に水 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 0.5 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 4mL を正確に量り、水を加えて正確に 25mL とし、試料溶液とする。別にピコスルファートナトリウム標準品（別途本品 0.5g につき、水分測定法の容量滴定法、直接滴定により水分を測定しておく）約 0.027g を精密に量り、水に溶かし、正確に 200mL とする。この液 2mL を正確に量り、水を加えて正確に 200mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 100 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、それぞれの液のピコスルファートのピーク面積 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。

ピコスルファートナトリウム ($C_{18}H_{13}NNa_2O_8S_2 \cdot H_2O$) の表示量に対する溶出率 (%)

$$= \frac{W_S}{W_T} \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{1}{C} \times \frac{225}{8} \times 1.037$$

W_S : 脱水物に換算したピコスルファートナトリウム標準品の量 (mg)

W_T : ピコスルファートナトリウム顆粒の秤取量 (g)

C : 1g 中のピコスルファートナトリウム ($C_{18}H_{13}NNa_2O_8S_2 \cdot H_2O$) の表示量 (mg)

試験条件

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：265nm）

カラム：内径 4.0mm，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：無水リン酸水素二ナトリウム 2.84g を水 800mL に溶かし、酢酸（100）を加え、pH4.5 に調整した後、水を加えて 1000mL とする。この液 600mL にアセトニトリル 100mL を加える。

流量：ピコスルファートの保持時間が約 7 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 100 μ L につき、上記の条件で操作するとき、ピコスルファートのピークの理論段数及びシンメトリー係数は、それぞれ 2000 段以上、2.0 以下である。

システムの再現性：標準溶液 100 μ L につき、上記の条件で試験を 6 回繰り返すとき、ピコスルファートのピーク面積の相対標準偏差は 2.0% 以下である。

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
10mg/g	15 分	85%以上

ピコスルファートナトリウム標準品 ピコスルファートナトリウム（日局）。ただし、定量するとき、換算した脱水物に対し、ピコスルファートナトリウム ($C_{18}H_{13}NNa_2O_8S_2$) 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集（オレンジブック）（平成 16 年 3 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 4）について（平成 16 年 2 月 23 日付け薬食発第 0223001 号、厚生労働省医薬食品局長）
- 3) 平成 23 年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成 24 年 8 月、厚生労働省医薬食品局監視指導・麻薬対策課）
- 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 16 年 2 月 23 日付け薬食発第 0223005 号、厚生労働省医薬食品局長通知）