

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2018. 4. 25 第 2 版（2018. 3. 16 初版）

有効成分	リスペリドン		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	リスペリドン細粒 1%「CH」	長生堂製薬
	2	リスペリドン細粒 1%「MEEK」	小林化工
	3	リスペリドン細粒 1%「NP」	ニプロ
	4	リスペリドン細粒 1%「アメル」	共和薬品工業
	5	リスペリドン細粒 1%「オーハラ」	大原薬品工業
	6	リスペリドン細粒 1%「サワイ」	沢井製薬
	7	リスペリドン細粒 1%「トーワ」	東和薬品
	8	リスペリドン細粒 1%「日医工」	日医工
	9	リスペリドン細粒 1%「ヨシトミ」	全星薬品工業
	10	リスペリドン細粒 1%「タカタ」	高田製薬
	11	リスペリドン細粒 1%「ファイザー」	ファイザー
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	リスパダール細粒 1%	ヤンセンファーマ
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> (25°C)	pKa <sub>1</sub> =3.11（ピリミジン環、滴定法） pKa <sub>2</sub> =8.24（ベンズオキサゾール、滴定法）		
溶解度 <sup>1)</sup> (37°C)	pH1.2：16.0mg/mL pH4.0：12.0mg/mL pH6.8：0.90mg/mL 水：0.23mg/mL		
原薬の安定性 <sup>1)</sup>	水	水懸濁液（pH8.5）、100°C、12 時間で 1.1%分解する。	
	液性（pH）	1mol/L 塩酸、100°C、5 日間は安定である。	
		1mol/L 水酸化ナトリウム、100°C、24 時間で 0.4%分解する。	
	光	リスペリドン固体は 17,000lx 下で 7 日間は安定である。	
その他	30%過酸化水素水、60°C、1 時間で <i>cisN</i> 酸化体 1.6%及び <i>transN</i> 酸化体 0.4%を生成する。		
膜透過性	なし		
BCS・Biowaiver option	なし		
薬効分類	117 精神神経用剤		
規格単位	1% 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	リスペリドン細粒1%「CH」	長生堂製薬	○			○
2	リスペリドン細粒1%「MEEK」	小林化工	○			○
3	リスペリドン細粒1%「NP」	ニプロ	○			○
4	リスペリドン細粒1%「アメル」	共和薬品工業	○			○
5	リスペリドン細粒1%「オーハラ」	大原薬品工業	○			○
6	リスペリドン細粒1%「サワイ」	沢井製薬	○			○
7	リスペリドン細粒1%「トーワ」	東和薬品	○			○
8	リスペリドン細粒1%「日医工」	日医工	○			○
9	リスペリドン細粒1%「ヨシトミ」	全星薬品工業	○			○
10	リスペリドン細粒1%「タカタ」	高田製薬	○			○
11	リスペリドン細粒1%「ファイザー」	ファイザー	○			○*

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。【3~4 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>2)</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。【5 ページ】

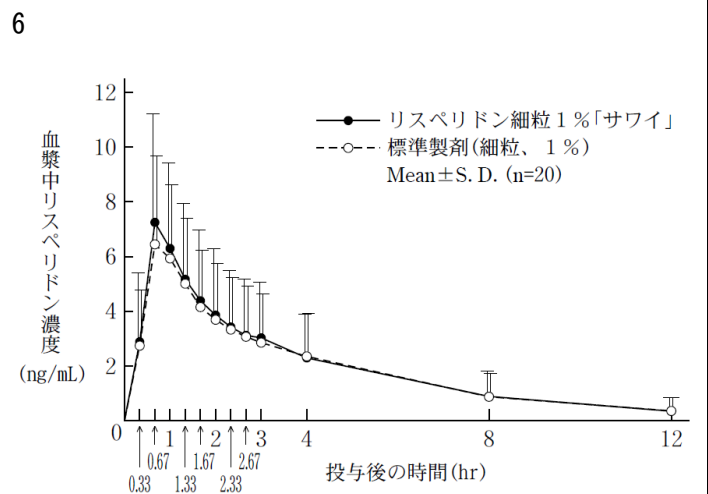
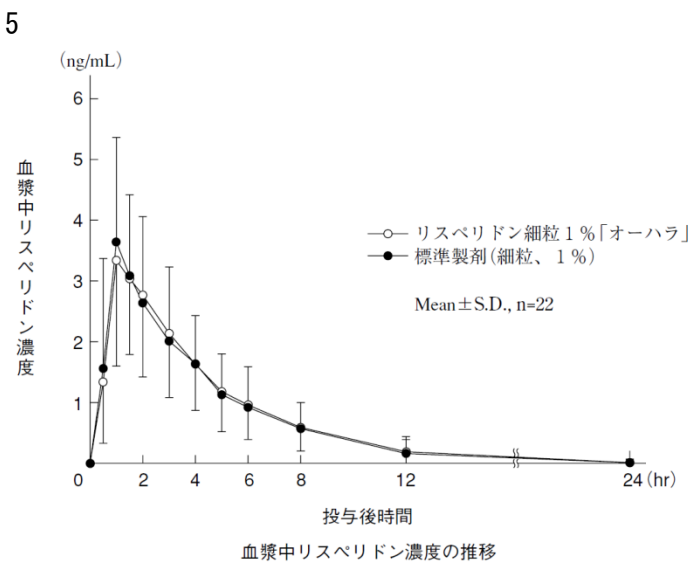
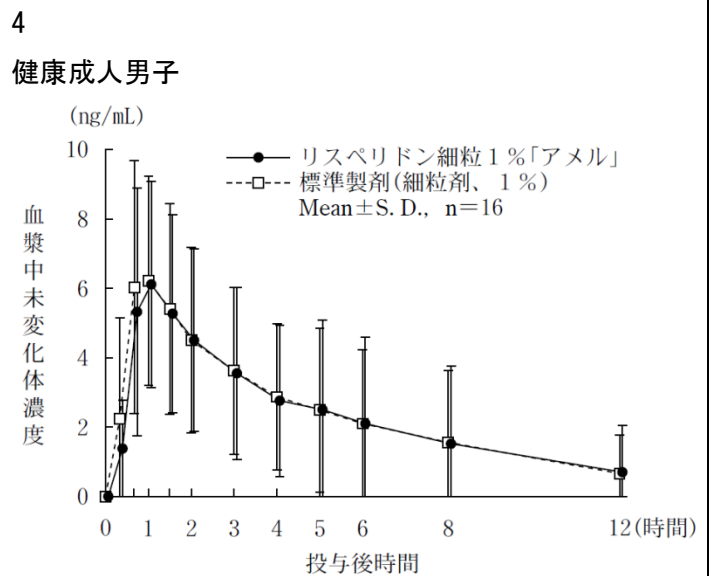
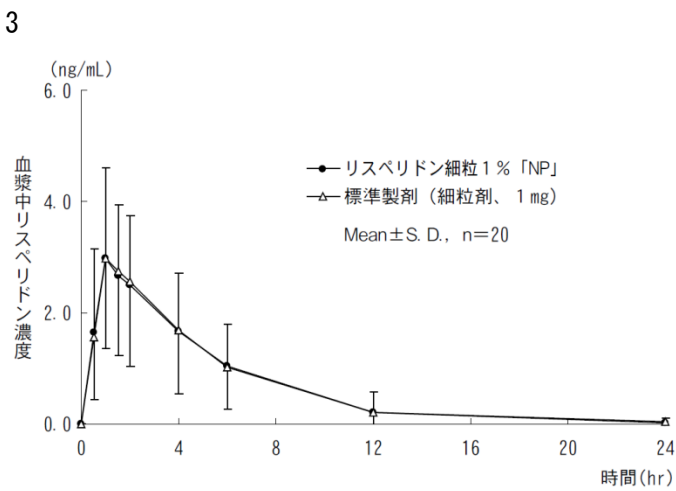
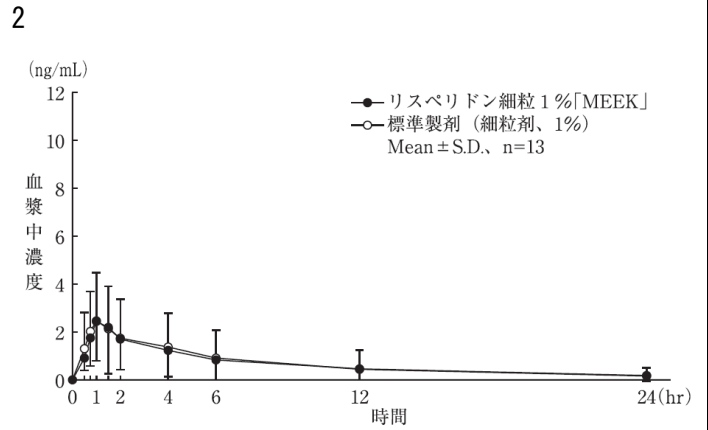
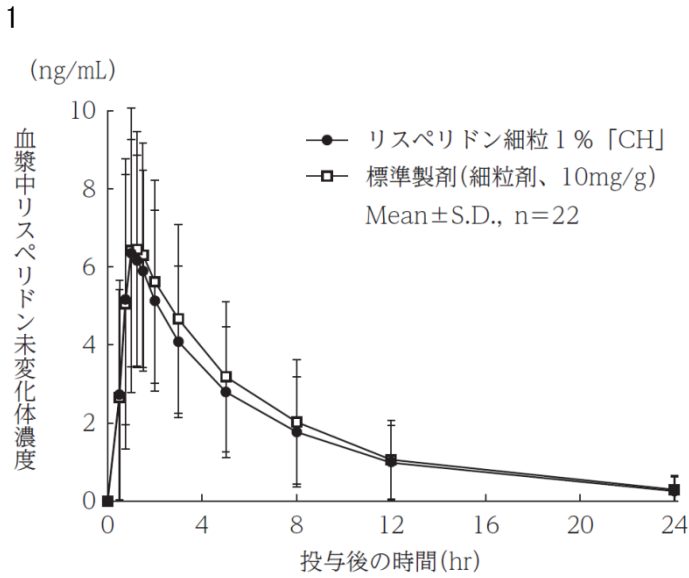
注)「溶出」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である（上記表中の番号は、本情報集に掲載された溶出試験結果中の番号と対応している。）。全品目で空欄となっている場合は、溶出試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【6 ページ】

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】

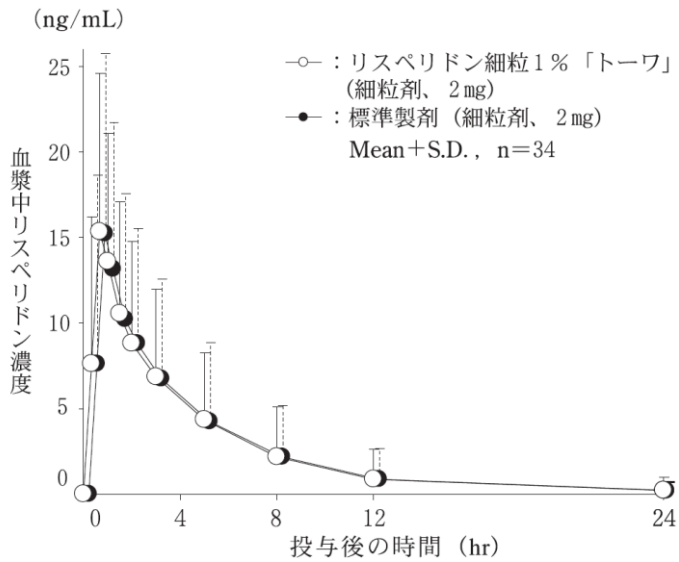
注) 大原薬品工業及び高田製薬の製剤は、承認時において共同開発されたものである（医薬品審査管理課調査による）。

\*：旧販売名で記載

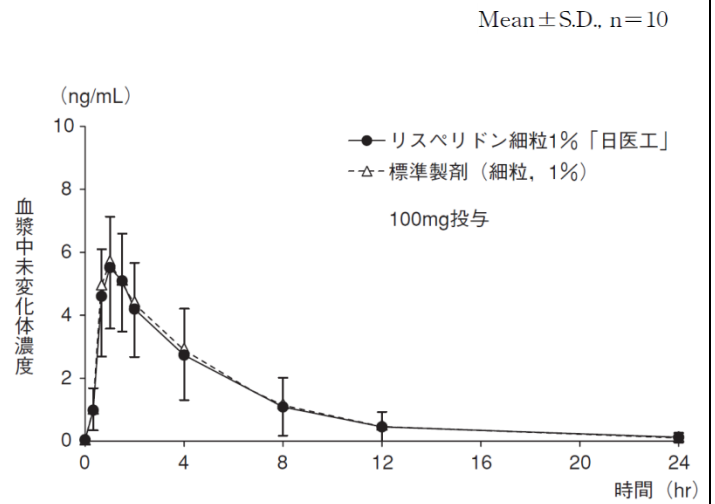
【生物学的同等性 (BE) 試験結果】



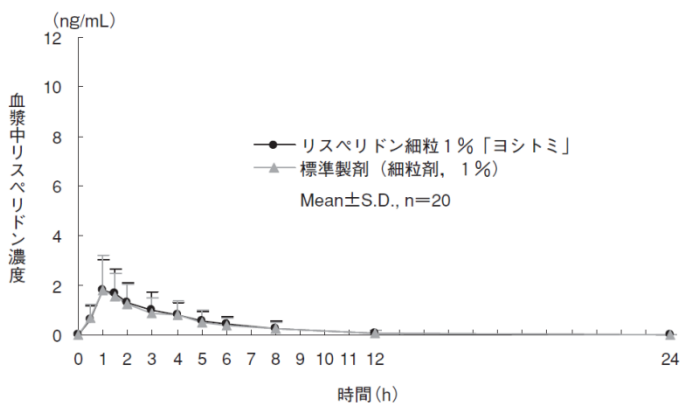
7



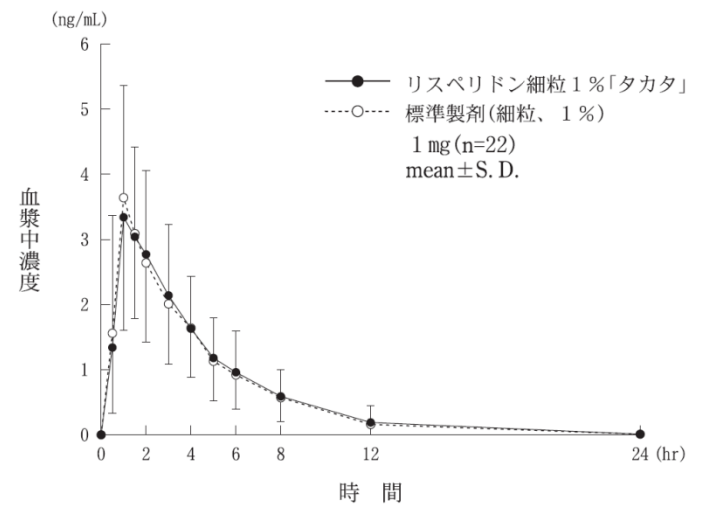
8



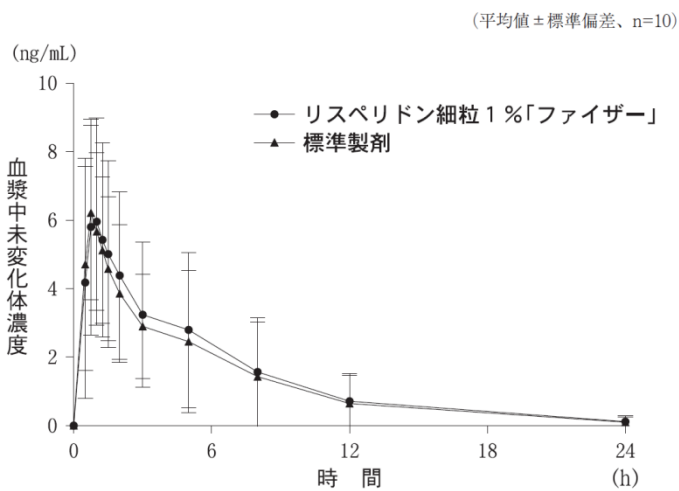
9



10



11



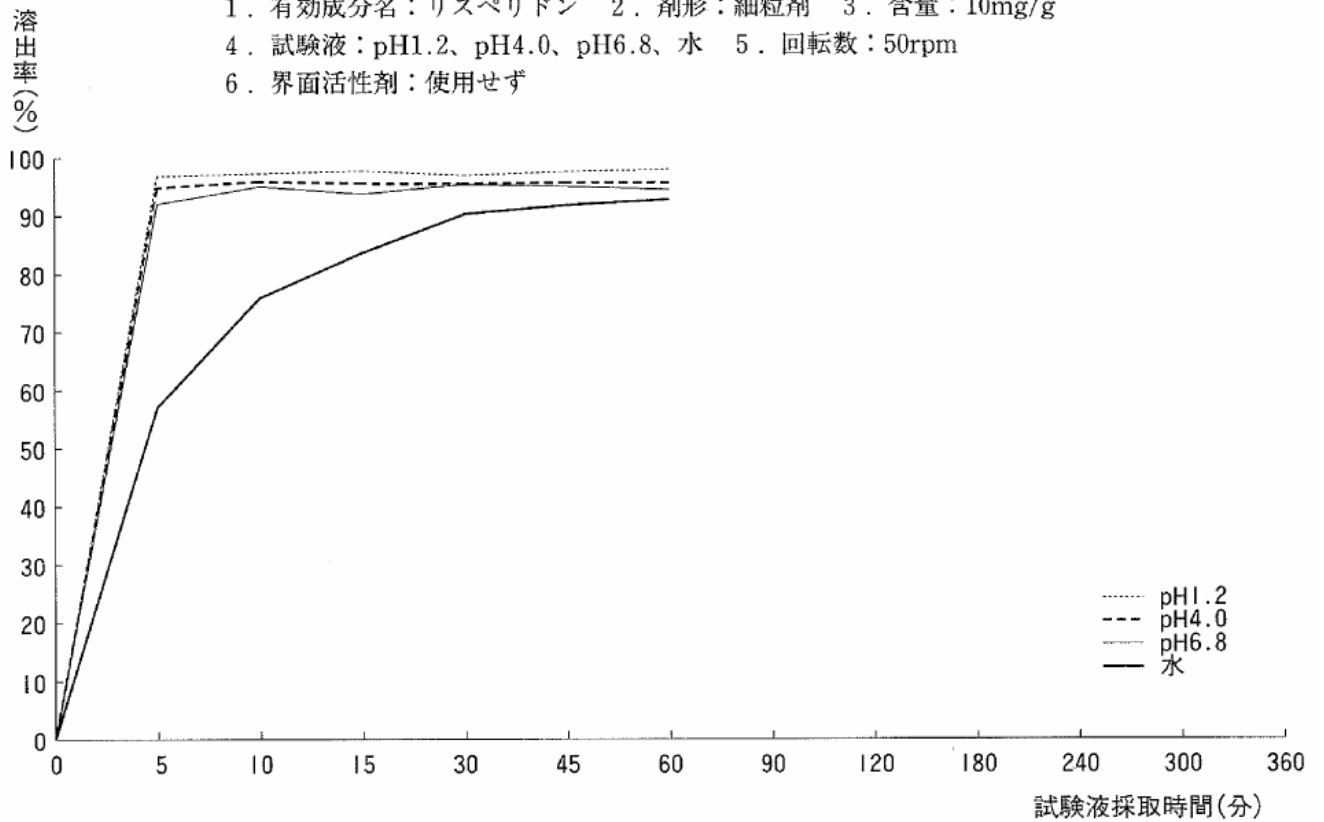
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】<sup>1)</sup>

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

リスペリドン細粒1%

- 1. 有効成分名：リスペリドン
- 2. 剤形：細粒剤
- 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】<sup>3)</sup>

平成 20 年度（溶出試験） 適
------------------

**リスペリドン細粒**  
**Risperidone Fine Granules**

**溶出性** 〈6.10〉 試験液に水 900mL を用い、パドル法により、毎分 50 回転で試験を行うとき、本品の 30 分間の溶出率は 75%以上である。

本品のリスペリドン ( $C_{23}H_{27}FN_4O_2$ ) 約 3mg に対応する量を精密に量り、試験を開始し、規定された時間に溶出液 20mL 以上をとり、孔径 0.45  $\mu$ 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 5mL を正確に量り、薄めた塩酸(1→137)を加えて正確に 10mL とし、試料溶液とする。別に定量用リスペリドン(別途「リスペリドン」と同様の条件で乾燥減量〈2.41〉を測定しておく)約 28mg を精密に量り、メタノールに溶かし、正確に 50mL とする。この液 15mL を正確に量り、メタノールを加えて正確に 25mL とする。この液 2mL を正確に量り、水を加えて正確に 200mL とし、この液 3mL を正確に量り、薄めた塩酸(1→137) 3mL を正確に加え、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 100  $\mu$ L ずつを正確にとり、次の条件で液体クロマトグラフィー 〈2.01〉により試験を行い、それぞれの液のリスペリドンのピーク面積  $A_T$  及び  $A_S$  を測定する。

リスペリドン ( $C_{23}H_{27}FN_4O_2$ ) の表示量に対する溶出率(%)

$$= M_S / M_T \times A_T / A_S \times 1 / C \times 54 / 5$$

$M_S$  : 乾燥物に換算した定量用リスペリドンの秤取量 (mg)

$M_T$  : 本品の秤取量 (g)

$C$  : 1g 中のリスペリドン ( $C_{23}H_{27}FN_4O_2$ ) の表示量 (mg)

**試験条件**

検出器 : 紫外吸光光度計(測定波長 : 237nm)

カラム : 内径 4.6mm、長さ 15cm のステンレス管に 5  $\mu$ m の液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル化シリカゲルを充填する。

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(13 : 7) 1000mL にトリフルオロ酢酸 1mL を加えた後、アンモニア水(28)を加えて pH3.0 に調整する。

流量 : リスペリドンの保持時間が約 3 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  $\mu$ L につき、上記の条件で操作するとき、リスペリドンのピークの理論段数及びシンメトリー係数は、それぞれ 3500 段以上、2.5 以下である。

システムの再現性 : 標準溶液 100  $\mu$ L につき、上記の条件で試験を 6 回繰り返すとき、リスペリドンのピーク面積の相対標準偏差は 2.0% 以下である。



【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 18 年 9 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 18 年度（その 1）について（平成 18 年 8 月 11 日付け薬食発第 0811002 号、厚生労働省医薬食品局長）
- 3) 平成 20 年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成 21 年 8 月、厚生労働省医薬食品局監視指導・麻薬対策課）
- 4) 第十七改正日本薬局方（平成 28 年 3 月 7 日厚生労働省告示第 64 号）