

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2023.07.05 初版

有効成分	ゾテピン					
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	ゾテピン細粒 10% 「ヨシトミ」			長生堂製薬	
	2	ゾテピン細粒 10% 「タカタ」			高田製薬	
	3	ゾテピン細粒 50% 「ヨシトミ」			長生堂製薬	
	4	ゾテピン細粒 50% 「タカタ」			高田製薬	
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	ロドピン細粒 10%			LTLファーマ	
	②	ロドピン細粒 50%			LTLファーマ	
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⁾ (25℃)	pKa' (注) : 7.0 (第三アミノ基、滴定法) (注) 測定溶媒 : 2-プロパノール/水混液 (2 : 1)					
溶解度 ¹⁾ (37℃)	pH1.2 : 10.0 mg/mL pH4.0 : 4.45 mg/mL pH6.8 : 0.004mg/mL 水 : 0.002mg/mL					
原薬の安定性 ²⁾	水	なし				
	液性(pH)	なし				
	光	苛酷試験				
		試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
		光	室内散光	無色透明ガラス瓶(密栓)	3箇月	各項目とも変化は規格内であった。
測定項目	性状、溶状、含量					
その他	試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果	
	長期保存試験	室温	無色透明ガラス瓶(密栓)	60 箇月	各項目とも変化は規格内であった。	
	苛酷試験	温度	50℃	無色透明ガラス瓶(密栓)	6 箇月	各項目とも変化は規格内であった。
		湿度	30℃、90% RH	無色透明ガラス瓶(開栓)	6 箇月	各項目とも変化は規格内であった。
測定項目	性状、溶状、含量、水分(30℃、90%RHのみ)					
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	10% 1g 50% 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	ゾテピン細粒10%「ヨシトミ」	長生堂製薬	○+	○*		
2	ゾテピン細粒10%「タカタ」	高田製薬	○	○*		
3	ゾテピン細粒50%「ヨシトミ」	長生堂製薬	○			○
4	ゾテピン細粒50%「タカタ」	高田製薬	○			

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。○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³⁾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)高田製薬、長生堂製薬の製剤は、承認時において他社と共同開発されたものである。

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1 <参考>

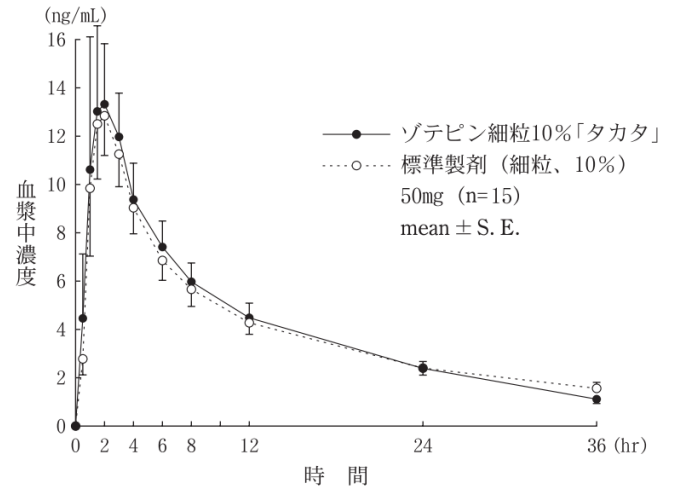
ゾテピン細粒 10%「ヨシトミ」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 1.5g (ゾテピンとして 150mg) 雄性ビーグル犬 (n=12) に単回経口投与し、血中ゾテピンの濃度について比較検討した結果、両製剤には統計学的に有意差のないことが認められた。

(社内資料より)

2

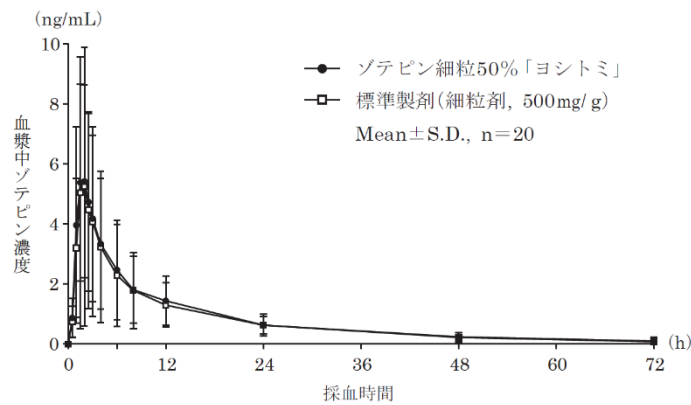
0.5g 投与

ゾテピンの血漿中濃度



3

50mg 投与

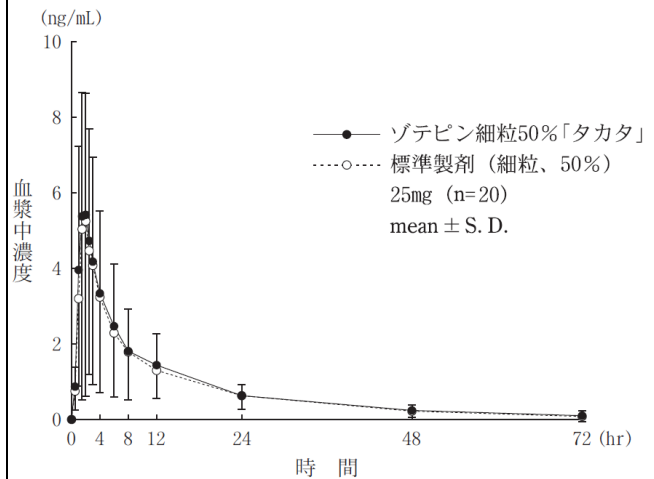


(インタビューフォームより)

4

50mg 投与

ゾテピンの血漿中濃度



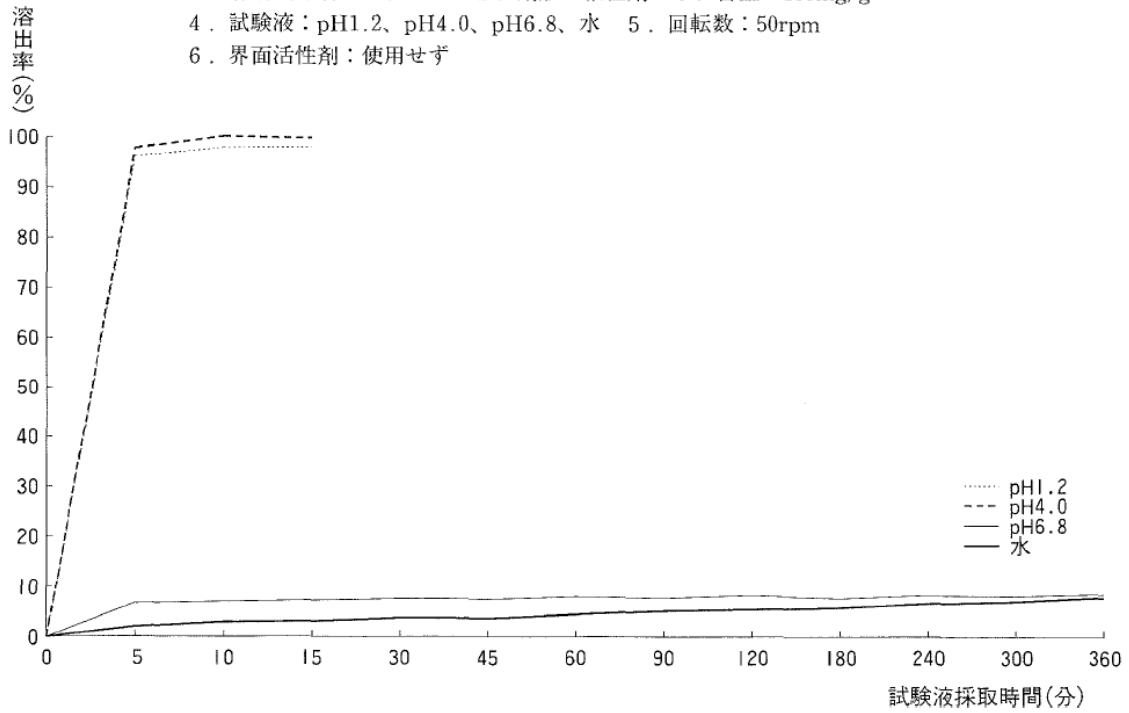
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

ゾテピン細粒10%

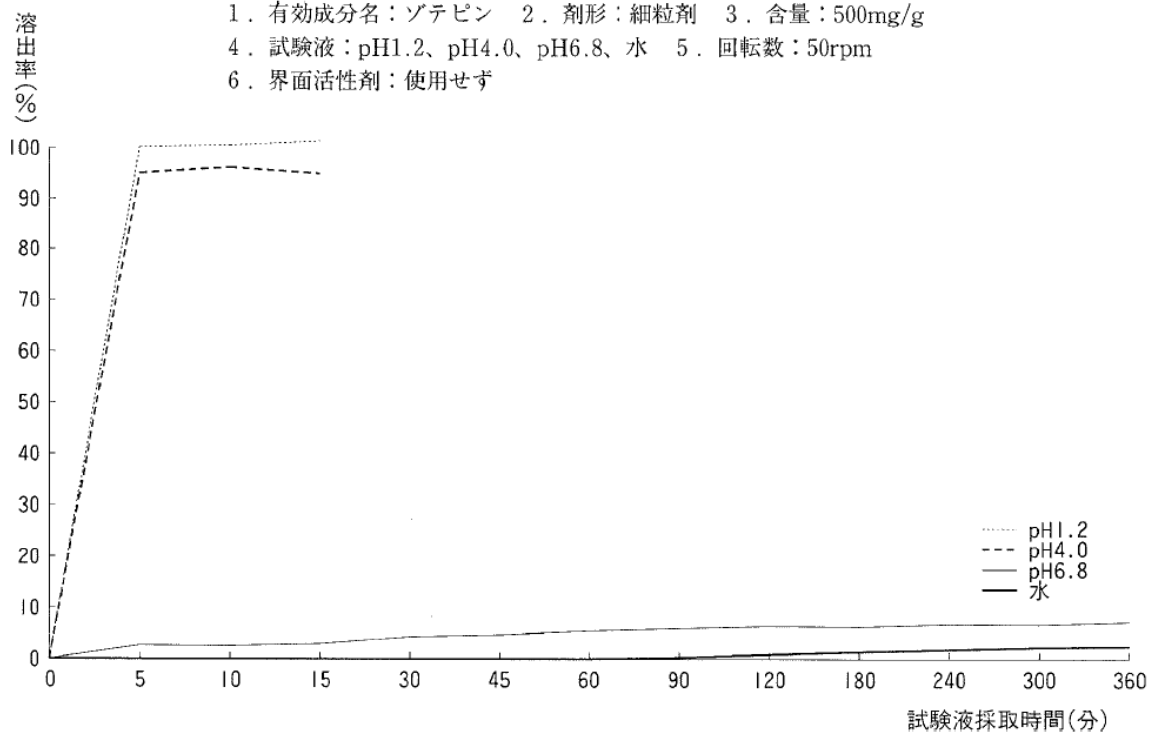
1. 有効成分名：ゾテピン
2. 剤形：細粒剤
3. 含量：100mg/g
4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
5. 回転数：50rpm
6. 界面活性剤：使用せず



溶出曲線測定例

ゾテピン細粒50%

1. 有効成分名：ゾテピン
2. 剤形：細粒剤
3. 含量：500mg/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】⁴⁾

令和元年度（溶出試験） 適

ゾテピン細粒
Zotepine Fine Granules

溶出試験 本品の表示量に従いゾテピン(C₁₈H₁₈ClNOS)約 0.1g に対応する量を精密に量り、試験液に pH4.0 の 0.05mol/L 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液 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。溶出試験開始し、規定時間後、溶出液 20mL 以上をとり、孔径 0.5 μm 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、pH4.0 の 0.05mol/L 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液を加えて正確に 20mL とし、試料溶液とする。別にゾテピン標準品を酸化リン(V)を乾燥剤として 2 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 50mL とする。この液 5mL を正確に量り、pH4.0 の 0.05mol/L 酢酸・酢酸ナトリウム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、pH4.0 の 0.05mol/L 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液を対照とし、紫外可視吸光度測定法により試験を行い、波長 295nm 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。

ゾテピン(C₁₈H₁₈ClNOS)の表示量に対する溶出率(%)

$$= \frac{W_S}{W_T} \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{1}{C} \times 360$$

W_S : ゾテピン標準品の量(mg)

W_T : ゾテピン細粒の秤取量(g)

C : 1g 中のゾテピン(C₁₈H₁₈ClNOS)の表示量(mg)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
100mg/g	15 分	85%以上
500mg/g	15 分	85%以上

ゾテピン標準品 「ゾテピン」。ただし、乾燥したものを定量するとき、ゾテピン(C₁₈H₁₈ClNOS)99.0%以上を含むもの。

酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液, 0.05mol/L, pH4.0 酢酸(100)3.0g に水を加えて 1000mL とした液に、酢酸ナトリウム三水和物 3.4g を水に溶かして 500mL とした液を加え、pH4.0 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 16 年 3 月版、厚生労働省医薬食品局審査管理課）
- 2) ロドピン錠 25mg／錠 50mg／錠 100mg／細粒 10%／細粒 50%（製造販売元：LTL ファーマ株式会社）医薬品インタビューフォーム（2021 年 9 月改訂、第 15 版）
- 3) 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）
- 4) 令和 2 年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（令和 4 年 3 月、厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課）
- 5) 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）