2.3 品質に関する概括資料

2.3.S 原薬

1) 名称

(1) 一般名

－ INN：stiripentol

（r-INN：List 15, Supplement to WHO *Chronicle*, vol.29, No.10（1975））

－ JAN

日本名　スチリペントール

英名　Stiripentol

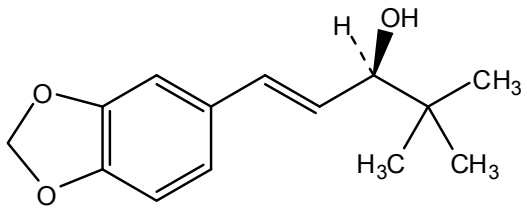
(2) 化学名

日本名　(1*E*,3*RS*)-1-(ベンゾ[*d*][1,3]ジオキソール-5-イル)-4,4-ジメチルペンタ-1-エン-3-オール

英名　(1*E*,3*RS*)-1-(Benzo[*d*][1,3]dioxol-5-yl)-4,4-dimethylpent-1-en-3-ol

2) 構造

(1) 構造式：



及び鏡像異性体

(2) 分子式：$C_{14}H_{18}O_3$

(3) 分子量：234.29

3) 物理的化学的性質

(1) 性状

白色 ～ 微黄色の結晶性の粉末であった。

※「2.3.S 原薬」の項を情報公表時に置き換えた。

(2) 溶解性

種々の溶媒に対するスチリペントールの溶解性（測定温度：25°C）

	1 g のスチリペントールの溶解に要する溶媒量(mL)	1 mL の溶媒に溶解するスチリペントールの量(g)	日本薬局方の表現
アセトン	2	0.50	溶けやすい
アセトニトリル	4	0.25	溶けやすい
ジクロロメタン	2	0.50	溶けやすい
エーテル	5	0.20	溶けやすい
ヒドロキシプロピル-β-シクロデキストリン（50 w/v%　水溶液）	40	0.025	やや溶けにくい
PEG 400	34	0.0294	やや溶けにくい
石油エーテル	500	0.0020	溶けにくい
水	20000	0.00005	ほとんど溶けない

(3) 安定性

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25±2℃/60±5%RH	ポリエチレン袋	36 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
中間的試験	30±2℃/65±5%RH	ポリエチレン袋	12 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
加速試験	40±2℃/75±5%RH	ポリエチレン袋	12 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
苛酷試験（熱・湿度）	60℃	開放容器（瓶）	4 週間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成は認めなかった。
		気密容器（瓶）	4 週間	
	25℃/90%RH	開放容器（瓶）	4 週間	
		気密容器（瓶）	4 週間	
	40℃/75%RH	開放容器（瓶）	4 週間	
		気密容器（瓶）	4 週間	
苛酷試験（光）	120 万 lx・hr 曝光	開放容器	8 日間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下を認めなかった。

※「2.3.S 原薬」の項を情報公表時に置き換えた。

2.3.P 製剤（ディアコミットドライシロップ分包 250mg，500mg）

1) 製剤及び処方

1 包中にスチリペントールを 250mg または 500mg を含む。

添加物	ポビドン、デンプングリコール酸ナトリウム、デキストリン、赤色 3 号、酸化チタン、アスパルテーム、カルメロースナトリウム EP、ヒドロキシエチルセルロース、香料

2) 安定性

【ディアコミットドライシロップ分包 250mg】

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25±2℃/60±5%RH	分包	36 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
中間的試験	30±2℃/65±5%RH	分包	36 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
加速試験	40±2℃/75±5%RH	分包	12 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
苛酷試験（熱・湿度）	60℃	内容物　開放	4 週間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
		分包	4 週間	内容物の色の変化を認めた。分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
	25℃/90%RH	内容物　開放	4 週間	内容物の凝集、含量の低下を認めた。分解物の生成は認めなかった。
		分包	4 週間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
	40℃/75%RH	内容物　開放	4 週間	内容物の色の変化、凝集、含量の低下を認めた。分解物の生成は認めなかった。
		分包	4 週間	若干の溶出率の低下傾向を認めた。分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
苛酷試験（光）	120 万 lx・hr 曝光	内容物　開放	8 日間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成を認めなかった。

※「2.3.P 製剤（ディアコミットドライシロップ分包 250mg，500mg）」の項を情報公表時に置き換えた。

【ディアコミットドライシロップ分包 500mg】

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25±2℃/60±5%RH	分包	36 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
中間的試験	30±2℃/65±5%RH	分包	36 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
加速試験	40±2℃/75±5%RH	分包	12 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
苛酷試験（熱・湿度）	60℃	内容物　開放	4 週間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
		分包	4 週間	内容物の色の変化を認めた。分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
	25℃/90%RH	内容物　開放	4 週間	内容物の凝集、含量の低下を認めた。分解物の生成は認めなかった。
		分包	4 週間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
	40℃/75%RH	内容物　開放	4 週間	内容物の色の変化、凝集、含量の低下を認めた。分解物の生成は認めなかった。
		分包	4 週間	若干の溶出率の低下傾向を認めた。分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
苛酷試験（光）	120 万 lx・hr 曝光	内容物　開放	8 日間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成を認めなかった。

※「2.3.P 製剤（ディアコミットドライシロップ分包 250mg，500mg）」の項を情報公表時に置き換えた。

2.3.P 製剤（ディアコミットカプセル 250mg）

1) 製剤及び処方

1 カプセル中にスチリペントールを 250mg 含む。

添加物	ポビドン、デンプングリコール酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム カプセル本体：ゼラチン、酸化チタン、赤色 3 号、青色 2 号

2) 安定性

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25±2℃/60±5%RH	ポリプロピレン瓶 気密	24 箇月 (36 箇月まで 実施予定)	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
中間的試験	30±2℃/65±5%RH	ポリプロピレン瓶 気密	12 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
加速試験	40±2℃/75±5%RH	ポリプロピレン瓶 気密	6 箇月	いずれの試験項目においても明確な品質の変化を認めなかった。
苛酷試験 （熱・湿度）	60℃	ポリプロピレン瓶 開放	4 週間	カプセル剤皮の脆弱化、内容物の固化を認めた。分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
		ポリプロピレン瓶 気密	4 週間	カプセル剤皮の粘着化、内容物の固化、若干の溶出率の低下傾向を認めた。分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
	25℃/90%RH	ポリプロピレン瓶 開放	4 週間	カプセル剤皮の湿潤化、若干の溶出率の低下傾向及び崩壊時間の遅延を認めた。分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
		ポリプロピレン瓶 気密	4 週間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
	40℃/75%RH	ポリプロピレン瓶 開放	4 週間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
		ポリプロピレン瓶 気密	4 週間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
苛酷試験 （光）	120 万 lx・hr 曝光	カプセル単独	8 日間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。
		ポリプロピレン瓶 気密	8 日間	当該条件に対して大きな影響を受けず、分解物の生成及び含量の低下は認めなかった。

※「2.3.P 製剤（ディアコミットドライシロップ分包 250mg，500mg）」の項を情報公表時に置き換えた。