

性状を充進するために添加される。

物理的性状：最も一般的な可塑剤は低分子量 (<500ダルトン) の固体または液体である。それらは典型的に低融点 (<100°C) で、常温で揮発性 (かなりの気圧で蒸起) を示す。可塑剤を添加するとシステムのガラス転移温度を有意に低下する。

化学的性状：既に記載のとおり、多くの最近の可塑剤はクエン酸やフタル酸のような合成エステルである。伝統的な医薬品可塑剤には、油、糖及びこれらの誘導体が含まれる。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：融解範囲又は温度<741>、水分測定<921>、有機揮発不純物<467>、比重<841>、屈折指数<831>及び熱分析<891>

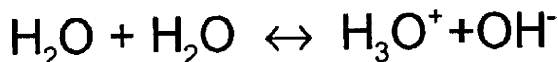
その他：適切な可塑剤の選択には、その凝集エネルギー密度と関連する「溶解度パラメータ」を参照する。多くの一般的な物質の溶解度のパラメータ値は標準的な文献教科書に掲載されている。効果を最大にするために可塑剤の溶解度パラメータ及び可塑化するポリマーシステムを出来るだけしっかり最適化しなければならない。

内用液剤

用途： pH調節剤 (酸性化剤・アルカリ化剤・緩衝剤)

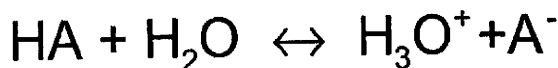
概要：水性液中の水素イオン濃度 H^+ は $pH = -\log(H^+)$ で示される。純水の pH は 25°C で 7 である。水性液は $pH < 7$ で酸性、 $pH > 7$ でアルカリ性となる。酸は溶液を酸性化するために添加する。同様に、塩基は溶液をアルカリ性化するために用いる。緩衝液は弱酸又は弱塩基及びその塩である。緩衝液は溶液に含まれると、強酸や強塩基の少量添加では溶液の pH は少ない変化になる。緩衝能は塩/酸 (塩基/塩) 比及び酸 (又は塩基) と塩の濃度により影響される。薬剤溶液の pH は一般に酸性化剤/アルカリ性化剤及び緩衝剤を用いて 1) 刺激性を避けるため体液に近い pH の維持、2) pH に依存する薬物安定性の改善、3) 弱酸又は弱塩基の平衡溶解度の管理、4) 化学分析中に一定の微粒子の電離状態を維持されている。

用途と機序：弱塩基、弱酸、水の電離平衡には酸性化剤、アルカリ化剤及び緩衝剤の役割が重要となる。水の自己分解反応は次のように示すことができる。



水の自動プロトン解離 (イオン積) 定数は 25°C で $K_w = 1 \times 10^{-14}$ であり、温度で有意に変動する。なぜなら、純水の水素と水酸基イオンの濃度は等しく、各々は 25°C で pH 7 の中性となる約 1×10^{-7} mole/L の値を示す。酸、塩基、又は弱酸 (又は弱塩基) の塩を添加したとき、水のイオン化平衡は移動するため $[H^+][OH^-]$ イオンは依然と変わらないままであるので pH は 7 と異なる溶液となる。

物理的性状：弱酸のイオン化平衡 HA は次のように記すことができる。



弱酸 (塩基の共役酸) のイオン化定数は一般に $K_a = [H_3O^+][A^-]/[HA]$ では $pK_a = -\log(K_a)$ と示される。 pK_a の低い値は強酸に相当する。同様に、弱酸 (塩基の共役酸) のイオン化定数は $pK_b = -\log(K_b)$ で示される。水のイオン化定数 ($pK_a + pK_b = pK_w$) は 25°C で 14 に相当する。緩衝剤及び pH 調節剤は溶液のモル浸透圧、浸透圧及び水の伝導度に影響を及ぼす。

化学的性状：化学分析を行ったとき、緩衝剤は試薬や被験物質と化学的に適合性が良く

なければならない。緩衝剤を生理系システムで用いたとき、薬剤の薬理的活性又は生体の正常機能を阻害してはならない。

一般事項：次の一般事項は選択したpH調節剤・緩衝剤の特性を一定に確保するために有益となる：水の伝導度<645>、pH<791>及びモル浸透圧・浸透圧<785>

用途：湿潤剤・可溶化剤

概要：可溶化剤は不溶性分子を溶解して使用することができる。それらは熱力学的に安定な溶液を得るように自然な相関移動を容易にして機能する。多くの可溶化剤は市販で入手が可能である。薬剤に使用可能な可溶化剤は動物で安全性と毒性を完全に評価されたものである。

用途と機序：可溶化剤は種々の異なる化学構造/クラスからなる。一部の可溶化剤はユニークな化学構造をもつ。例えば、親水性部分は水中で独特のミセル状態・形態で疎水性部分を捕捉して、可溶化する。可溶化の機序は不溶性物質との好ましい相互作用及び可溶化剤の集合（ミセル等）内部の中心との関連をしばしば有する。その他の場合として包接錯体を形成することができるユニークな疎水性部位がある。その他の種類の可溶化剤は一連のポリマー鎖を利用して不溶性物質をポリマー鎖に溶解させて疎水性分子の溶解度を増加させることに関与する。

物理的性状：可溶化剤の材質には固体、液体、又はワックスがある。これらの物理的性状は、それらの化学構造に依存する。しかしながら、可溶化剤の特性と物理的性状は、可溶化剤の界面活性特性と親水性-親油性バランス（HLB）にも依存している。HLBが低い値の可溶化剤は乳化剤として作用し、HLBの高い値のものは可溶化剤として働く。例えば、ラウリル硫酸ナトリウム（HLB 40）は親水性で水に高溶解性のため、水に分散し、自然にミセル構造を作る。

親水性と疎水性の特性をもつユニークな可溶化剤は、その集合体数又は臨界ミセル濃度（CMC）が特徴である。CMC値は親水性、親油性、疎水性鎖による個々の可溶化剤に特有のものである。CMCは界面活性分子を集合させ、外側の親水性の残基を水層に適合させ、疎水性内部に溶質を組み込むことにより可溶化する一定の濃度である。そのような不溶性分子との相互作用は、沈殿することなく継続的に完全な溶液としてさらに安定化する。

化学的性状：化学的及び界面活性の特性は可溶化剤の化学構造に依存している。溶質・溶媒・可溶化剤の相互作用による複合的な性状のために製剤研究者は可溶化剤の臨界材料特性を注意深く検討、同定、管理しなければならない。

一般事項：次の一般事項は選択した可溶化剤の特性を一定に確保するために有益となる：脂肪・不揮発性油<401>、比重<841>、pH<791>、比表面積<846>、熱分析<891>、光散乱分光光度法<851>、走査電子顕微鏡法<1181>、粘度<911>及び粒度の光回折測定<429>

用途：抗菌性保存剤

概要：抗菌性保存剤は製剤における細菌、酵母菌、カビの繁殖を阻止又は死滅させるために用いる。

用途と機序：保存剤は種々の機序で作用し、微生物を管理する。主なものでは、細胞膜に作用して、膜の障害を引き起こし、細胞漏損に導く。その他の作用機序は輸送阻害、たんぱく質の沈着やプロトン伝導性の脱共役である。一部の保存剤は殺滅剤（細菌、酵母菌又はカビの死滅）、一部は静菌剤（微生物の成育阻害）、その他は殺孢子剤（孢子の死

滅)である。数種の保存剤では、相乗的に作用することができる(パラベンの併用等)。

物理的性状：抗菌剤は一般に薬効を示す濃度範囲では、水溶性である。これらの添加剤の気化圧力は、製剤を凍結乾燥や噴霧乾燥にする場合には特に重要となる。これらの抗菌剤の一部は可燃性である。添加物の分配係数を知ることは重要で、油層内に保存剤の分割層ができると水層における保存剤の濃度がなくなり、保存剤としての価値が減少することになる。

化学的性状：フェノール系保存剤は酸化や着色を惹起することがある。保存剤との不適合(陽イオンと陰イオンの混合、チューブやフィルターとの接着、界面活性剤とたんぱく質の結合)は製剤開発の段階で洗い出さなければならない。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：注射<1>、抗菌作用試験<51>、微生物限度試験<61>及び抗菌剤含量<341>

その他：安全性及び表示の要領に関する留意事項として、特に塩化ベンザルコニウム(眼及び皮膚刺激性)、安息香酸及び安息香酸エステル塩(新生児における黄疸のリスク)、ベンジルアルコール(未熟児、又は新生児への禁忌、3歳未満乳幼児でアレルギー反応の可能性)、プロノポール(皮膚反応の可能性)、クロロクレゾール(アレルギー反応)、有機水銀化合物(アレルギー反応)、パラベン(アレルギー反応)、ソルビン酸と塩(皮膚反応)があげられる。有機水銀毒性のリスクのあることから、チメロサルは使用すべきではない。保存剤の使用は総量30mL以上、又は脳脊髄液に投与する非経口製剤には禁忌である。抗酸化剤及びキレート剤は抗微生物作用を促進する傾向がある。

用途：キレート剤・錯化剤

概要：キレート剤/錯化剤は特定の金属イオン(銅、鉄、マンガン、鉛、カルシウム等)と水溶性錯体分子を形成し、原則的に他の成分と反応する金属イオンの機能を除去、又は最小化あるいは沈殿して溶液からイオンを除去する。キレート剤/錯化剤は溶液からイオンを隔離して安定な錯体を作るため医薬品(経口、非経口及び外用製剤)、化粧品及び食品で用いられている。また、キレート剤はキラント(chelants)、キレート剤(chelators)、金属イオン封鎖剤(sequestering agents)と呼ばれている。

用途と機序：キレート剤/錯化剤は溶液から好ましくない金属イオンを捕捉するために用いられる。これらの化学構造は複素環構造を作り、金属原子をつかむ「爪(claw)」作用をする。錯化剤も同様に作用するが、メカニズム的に2個の爪構造を(本質的には)必要としない。なぜなら、1個又はそれ以上の結合部位で作用するためである。全てのキレート剤は錯化剤であるが、全ての錯化剤がキレート剤とはならない。添加物として、キレート剤は抗酸化共力剤、抗菌共力剤、軟水剤として用いられる。溶液から金属イオンの「除去(removing)」により、キレート剤は酸化反応する傾向を減少する。また、キレート剤は微生物を増殖させる金属イオンを欠乏環境にして抗菌効果を促進する能力ももつ。

物理的性状：キレート剤/錯化剤は水に溶けやすい。エデト酸には各種の塩(二ナトリウム及びカルシウム二ナトリウム)及び水和物(無水、二水和物、三水和物)が存在する。エデト酸及びその誘導体は白色ないし帯白色(オフホワイト)の結晶性固体である。硫酸オキシキノロンは黄白色の結晶性粉末である。USP-NFでは、キレート剤/錯化剤は100°C未満で安定であるが、それ以上の温度では脱水や分解が起こりうると認められている。キレート剤には種々の程度の吸湿性が認められる。キレート剤の処方濃度は低い(一般的に0.2%以下)ため、固体製剤におけるバルク固体の機械的及び流動性特性に意義ある効果が期待できない。これらの添加剤は非常に低い濃度で用いることから、粒度分布が許容範囲内の剤型で成分均一性を可能にすることが重要である。

化学的性状：キレート剤/錯化剤は金属イオンとイオン結合及び共有結合により錯体を作る。希釈水性液は中性、酸性、又はアルカリ性を示す。エデト酸とその塩は強力な酸化剤、強力な塩基、多価金属イオン（銅、ニッケル等）とは不適合となる。特異な添加剤とは溶解度、標的金属イオンとの親和性、安定性に基づいて選択、処方する。エデト酸塩は、その遊離酸と比べて溶解性が高い。エデト酸カルシウム二ナトリウムはその他のエデト酸とその遊離酸とは異なり、カルシウムを捕捉しないことから、低カルシウム血症を防ぐことが期待される。また、カルシウムイオンを遊離して重金属をキレートすることも望まれる。代替法として、エデト酸二ナトリウムは高カルシウム血症の治療ができる。エデト酸は150℃以上でカルボキシル基を除去する。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：抗菌作用試験<51>、微生物計数試験<61>、重金属<231>、鉄<241>、鉛<251>、抗菌剤含量<341>、粒度の光回折測定<429>、乾燥減量<731>、pH<791>、水分測定<921>、バイオテクノロジー応用品目<1045>、細胞及び遺伝子療法製剤<1046>、細胞療法製剤の製造

用途：抗酸化剤

概要：この分類では、酸化プロセスを軽減するため医薬品の*in vitro*安定化剤として用いられる抗酸化剤を適用する。*In vivo*における生物活性のために利用する抗酸化剤は治療効果のある活性成分とみなされ、ここでは議論しない。抗酸化剤は原薬に有害な影響を与える酸化反応の発現を遅延させ、その合成割合を有意に減少される。また、抗酸化剤は不飽和油、PEG化脂質、香料、エッセンシャルオイルのような不活性成分の保護ができると考えられる。従って、抗酸化剤は酸化ストレスに対する剤型の完全性を総合的に維持する。連鎖反応の発現遅延や抑制又は以下に示すカスケードプロセスに関わるヒドロペルオキシド及びフリーラジカル抑制のために抗酸化剤を処方に組み込めば最も効果的なものとなる。抗酸化剤の効果的な応用及びその効果の評価には、生成される副生物の性状及び酸化機序の解明を必要とする。フリーラジカル ($RH \rightarrow R\cdot$) として知られる極めて高い反応種を形成する基質と酸素が反応する場合に抗酸化剤は働く。反応の開始 (initiation) 後、酸素の存在下でフリーラジカルは連鎖反応 ($R\cdot + ROO\cdot$ 及び $ROO\cdot + RH \rightarrow R\cdot + ROOH$) の引き金となり、ペルオキシラジカル、ヒドロキシペルオキシド、新アルキルラジカルを形成し、それぞれの連鎖反応が伝播する。拡大相におけるカスケード反応は熱、光、金属触媒により促進される。微量な金属触媒 (Cu^+ 、 Cu^{2+} 、 Fe^{2+} 、及び Fe^{3+}) の存在下で、ヒドロペルオキシド (ROOH) は迅速に $RO\cdot$ と $ROO\cdot$ とに分解され、次いでAPIや添加物 (炭化水素等) との反応の引き金となり、ヒドロキシ酸、ケト酸、アルデヒドを形成し、さらに好ましくない結果を生む。ヒドロペルオキシドは製剤内酸化機序の唯一の反応生成物ではないことに留意する。また、ヒドロペルオキシドの残留はポリエチレングリコール (PEG)、ポリビニルピロリドン (PVP)、ポリソルベートのような通常用いられる添加物でも検出される。開始相では、一般に反応は遅く、最終製剤の品質への影響は限られている。拡大相では、対照的に反応は迅速で、化学種の不可逆的な劣化を引き起こす。

用途と機序：抗酸化剤はその機序による分類ができる。また、フリーラジカル連鎖反応を阻止するフェノール系酸化防止剤は真又は一次抗酸化物質として知られる。この群は環置換を行う一水酸基又は多水素酸基フェノール化合物よりなる。これらはラジカル電子の代わりに水素原子を提供する活性化エネルギーが非常に低く、フリーラジカルにより迅速に非局在化する。そのラジカル電子を受け入れることにより、フリーラジカルを安定化する。その反応で抗酸化剤フリーラジカルを産生、脂質フリーラジカルとも反応して多くの他の安定化合物を形成する。それ故、開始相及び拡大相の両方で酸化的連鎖反応を阻害することができる。それらの溶解挙動から、フェノール系酸化防止剤は酸化ストレスに対

して油脂及び油溶性活性体を保護するには最も効果的である。還元剤は一般的に薬物や保護目的の添加物より酸化還元電位の低い水溶性酸化防止剤（L-アスコルビン酸等）である。酸素及びその他の反応種との犠牲的な反応で、酸化反応率や開始を遅らせる。還元剤の酸化除去能はpHに敏感で、微量の金属の存在下では逆の影響を与えることがある。キレート剤は製剤中の微量な遊離金属（ Cu^+ 、 Cu^{2+} 、 Fe^{2+} 及び Fe^{3+} ）と結合する。新たに形成された錯イオンは反応性がない。従って、キレート剤は拡大相で惹起した酸化反応で金属触媒能を取り去る。

還元剤やキレート剤と一緒に1個や2個の一次抗酸化剤の相乗利用により、酸化防止剤の効用は極大化できる。併用効果は抗酸化剤の個別の作用の総和より大きくなることしばしばみられる（相乗効果）。

物理的性状：原薬が極めて溶けやすい場合には、抗酸化剤の溶解度は製剤型において最大とすべきである。抗酸化剤が分解する温度は、抗酸化活性の低下が考えられるオートクレイブ滅菌で重要である。また、抗酸化剤の安定性は考えなければならず、pHの作用や製造工程の条件による。金属イオンは着色複合体を生成する没食子酸プロピルと反応する可能性がある。アルカリ性pH、特定たんぱく質とナトリウム塩が*tert*-ブチルヒドロキノン(TBHQ)の退色を引き起こす可能性がある。

化学的性状：活性化エネルギー、酸化還元電位、種々の処方（pH等）及び工程（熱等）条件は重要な化学的性状である。製剤の予想有効期間が抗酸化剤に依存する場合には、その濃度を考慮に入れなければならず、安全量の限界を超えないように十分な量の抗酸化剤の残存を担保するよう定期的に査定しなければならない。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の抗酸化機能を評価するために有益となる：比表面積<846>、結晶化度<695>、クロマトグラフィー<621>水分測定<921>、融解範囲又は温度<741>及び鉄<241>

用途：甘味剤

概要：甘味剤は経口剤型に甘味を加えることと、好ましくない香味を隠すために用いられている。

用途と機序：甘味剤は舌の甘味を感じる味蕾受容体と結合する。甘味剤分子が受容体に付着する時間が長いほど、甘味剤の甘味をより甘く感じる。甘味の標準は白糖である。

物理的性状：甘味剤に関連する一次物理的性状は剤型中の他の成分（酸性成分等）との親和性、製造工程の状態（加熱等）、粒子径及び分散性、含水量、異性、甘味、味覚マスキング能と関連する。これらの性状は剤型・処方によるところが大きい。

化学的性状：甘味剤は主に糖（環状構造）、糖アルコール（環状構造を持たない糖）、人口甘味料の3つに分類される。すべての甘味剤は水溶性である。多くの甘味剤の安定性はpHや剤型中の他の成分によって左右される。甘味剤の一部では、特に液体や製造工程に加熱が加わる場合に、ある活性成分の分解を触媒することがある。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：旋光度<781>、比旋光度、水分測定<921>、乾燥減量<731>及び融解範囲又は温度<741>

その他：アスパルテームを含む製剤は使用上の注意にフェニールアラニンが含まれることを明示しなければならない。糖アルコールの血糖インデックスはブドウ糖よりはるかに低い。しかしながら、ソルビトールは緩徐に果糖とブドウ糖に代謝され、血糖値を上昇

させる。液状製剤では、特に糖アルコールは浸透圧緩下剤として20 g/日以上の方が一般的に含まれる。一部の甘味剤では、ある保存料と相性が悪く、この甘味剤との相性の悪さを避けるため、防腐のためには注意深く選択しなければならない。

半固形剤・外用剤・坐剤

用途：坐剤基剤

概要：坐剤基剤は坐剤（直腸内投与）、膣坐剤（膣内投与）の製造に用いる。それらは疎水性、又は親水性である。

用途と機序：坐剤は、薬物を基剤に懸濁させた場合、又は薬物を基剤で溶解させた場合、いずれも坐剤の浸食及び分解により薬物を放出させるためには、体温（37℃）以下で融解しなければならない。ハードファット坐剤基剤はほぼ体温で融解する。また、親水性坐剤基剤は体温で融解し、通常は水性媒体に溶解、又は分散する。したがって、薬物の放出は坐剤の浸食及び溶解の連携により起こる。

物理的性状：坐剤基剤の重要な物理的性状は融点の範囲にあることである。一般的に坐剤基剤は27～45℃で融解する。しかし、個々の基剤では、これらの境界温度よりはるかに狭い融解温度範囲の2-3℃が一般である。他の製剤成分により最終製剤の融解温度範囲が影響を受けることから、特定の融解温度範囲の基剤を選択する。

化学的性状：ハードファット坐剤基剤は長鎖脂肪酸の半合成トリグリセリドエステル混合物である。それらには、モノグリセリドとジグリセリドが種々の比率で含まれ、エトキシ化脂肪酸も含まれる。それらは融解温度範囲、ヒドロキシル価、酸価、ヨウ素価、凝固範囲、けん化価により種々のグレードに差別化された基剤が入手できる。

親水性坐剤基剤は親水性半固型物質の混合物であり、室温では固体で、患者への投与で融解、浸食、溶解して一気に放出する。親水性坐剤基剤はハードファット坐剤基剤より水酸基、又は他の親水基が高い水準となる。適切な融解挙動を示すポリエチレングリコールは親水性坐剤基剤の手本である。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：脂肪・揮発性油<401>、凝固温度<651>、融解範囲又は温度<741>及び製剤形<1151>

その他：ハードファットの坐剤基剤に含まれる物質が融解温度範囲をかなり上昇させる。これらの物質は溶融懸濁製剤を安定化に役立つ一般的な微結晶ワックスである。また、坐剤はグリセリン・ゼラチンから製造する。

用途：懸濁（化）剤・粘着剤

概要：懸濁（化）剤、粘着剤は分散系（懸濁、乳化）の安定化、溶質率の減少、微粒子の内部移動の減少、液剤の流動性の減少を目的に医薬品製剤で用いられる。

用途と機序：これら添加剤の分散安定化、粘度増強作用には多くの機序が関与している。最も一般的には高分子鎖、粘度小板、層流の排除による溶剤の取り込みで粘性を増強させる。その他の機序としては添加物分子、粒子の3次元ネットワークによるゲル形成であり、分散相の小滴や粒子の表面に吸着する分散媒体の高分子成分、鋳物成分において、溶媒連続体及び分子配列の固定化を行う。後者の2つの機序は分散相を固定することにより製剤の安定性を増強させる。

物理的性状：各々の作用機序は、粘度増加、ゲル形成の増加、分子配列の固定化の増強であり、添加物の流動学的特性の表れである。これら添加物の分子量及び粒子径のため

に、分散の流動学的特性は非ニュートンである。これらの添加物の分散は粘弾性特性を示す。このカテゴリーの高分子添加物の多分散性及び分子量分布はその性状の重要な基準となる。

化学的性状：懸濁（化）剤、粘着剤の主要なものは(a) 親水性高分子炭水化物（アラビアゴム、カンテン、アルギニン酸、カルボキシビニル、カルメロース、カラギーナン、デキストリン、ジェランガム、グァーガム、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース（ヒプロメロース）、マルトデキストリン、メチルセルロース、ペクチン、ポリエチレンオキシド、ポリビニルアルコール、アルギン酸プロピレングリコールエステル、デンプン、トラガント、キサンタンガム）、(b)ゼラチン、ポビドン、ポリエチレンオキシド、ポリビニルアルコールを含む親水性高分子炭水化物である。無機物（アタパルジャイト、ベントナイト、ケイ酸アルミニウムマグネシウム、二酸化ケイ素）は懸濁（化）剤、粘着剤における2番目に大きなグループを構成する。モノステアリン酸アルミニウムはこの用途のカテゴリーにおける非高分子、非無機添加物である。それは主にモノステアリン酸アルミニウム、モノパルミチン酸アルミニウムのさまざまな比率から得られる。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：粘度<911>

用途：軟膏基剤

概要：軟膏は粘性のある半固形の製剤であり体表面の色々な場所に局所的に適用される。軟膏基剤は軟膏の主要成分で、その物理的性状を左右する。

用途と機序：軟膏基剤は薬剤の局所適用の媒体として提供され、皮膚の軟化・保護剤でもある。

物理的性状：軟膏基剤は相対的に粘度が高い液体であることから、固体は安定した混合物として浮遊することができる。

軟膏基剤は次のように分類される：油脂性軟膏基剤（ワセリン等）は無水で、直ちに水分を吸収せず、水に不溶性であり、水により洗浄できない。(b) 給水軟膏基剤（ラノリン等）は無水で、ある程度の水分は吸収するが、水に不溶性であり、水により洗浄できない。(c) 乳剤性軟膏基剤（水性クリーム、油脂、ワックス、パラフィン等）は油中水滴又は水中油滴乳濁液で、含水性、吸水性であり、水に不溶性である。(d) 水溶性軟膏基剤（ポリエチレングリコール等）は無水で吸水性があり、水に溶解性で水により洗浄できる。

化学的性状：軟膏基剤は化学的に安定で不活性なものが選択される。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：粘度<911>及び凝固温度<651>

用途：硬化剤

概要：硬化剤は単剤、又は混合剤で製剤、特に軟膏やクリームの粘度や硬度を増す。

用途と機序：一般的に、硬化剤は高い融点の固体で軟膏の融点を上げ、一貫性やクリーム本体を高める。硬化剤は疎水性（ハードファット、パラフィン等）か、親水性（高分子量のポリエチレングリコール等）である。

物理的性状：硬化剤に関連する一次物理的性状は、高い融点、又は融解範囲となる。硬化剤の一般的な融解範囲はセチルエステルワックスで43°C~47°C、ジステアリン酸グリ

セリルで53°C~57°C、グリセリルベヘナートで69°C~74°C、硬化油で85°C~88°Cである。

化学的性状：硬化剤は多様性のある物質群からなり、飽和脂肪酸グリセリド、固体脂肪族アルコール、飽和脂肪アルコール及び飽和脂肪酸エステル、飽和炭化水素、脂肪族アルコールの混合物及びソルビタン脂肪酸エステルのポリオキシエチレン誘導体、高分子エチレングリコールからなる。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：融解範囲又は温度<741>、凝固温度<651>及び粘度<911>

その他：硬化剤として含まれている一部の物質は、軟膏（ワセリン）等の保水用量の増加、又はクリームにおける共乳化剤として作用する。例えば、ステアリルアルコールやセチルアルコールが含まれる。

用途：軟化剤

概要：軟化剤は外用剤で用いられる添加物であり、滑らかに容易に拡散し、質感及び皮膚の柔らかさを高め、皮膚における界面活性剤の乾燥や刺激性作用の可能性を防ぐ。

用途と機序：軟化剤は保護膜の形成を助け、表皮のバリアー機能を維持する。それらの効果は3つの作用機序で表せる：界面活性剤の脱脂及び乾燥に対する保護、閉鎖環境（皮膚表面を油脂相により覆われ、軟化剤によるゆっくりとした水分損失で、角質層の保湿度の増加）による保湿及び潤滑性で製剤の滑りを良くする。

物理的性状：軟化剤は次のような医薬品製剤に1つ以上の機能を提供する。：拡散量、好ましい触感、柔軟な皮膚、表皮からの水分損失を防いで皮膚の間接的な保湿。

化学的性状：軟化剤は油脂又は脂肪酸エステルとしての油脂の成分に由来するものである。その脂肪酸エステルの特性により、軟化剤は液体、半固体、室温で固体である。一般的に脂肪酸部分の分子量（炭素鎖）が高いと手触りの柔軟さ、感触が豊かになる。一般に遊離脂肪酸部分の酸素鎖が短く、不飽和度が高くなると流動性は増す。また、エステル結合の分枝の程度は軟化剤の特性に影響を及ぼす。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：脂肪・揮発性油<401>

非経口剤

用途：医療用水

概要：水は多くの医薬品製剤の溶剤、希釈剤、充填剤として用いられ、特に液剤として提供される。これらには、注射剤、眼科用剤、経口液、吸入液等が含まれる。水は緩衝液、抗菌剤の溶媒でもあり、点滴液の増量剤でもある。製剤調製における用途としては、固形経口製剤の造粒調製、軟膏及びジェルの調製への応用も含まれる。

米国薬局方（USP）では、医療用水に8段階のモノグラフが含まれている。これらUSPにおける水のタイプは、製剤研究者がヒト又は動物用医薬品調製時の水の実験室での1つとなる。しかし、USPでは、蒸留水、脱イオン水及びその他の種類の水の基準を一般事項の医薬品用水（1231）の章にまとめ、特定使用のためとしている。

用途と機序：溶媒は分子間引力を分離することができ、それぞれの分子をバルクの溶媒に分散することにより物質を溶解する。水は取扱が容易で、安全で安価であることから、多くの用途で好ましい溶媒、媒体となる。

物理的性状：水は標準温度、標準圧力で液体である。水は気圧によるが、0°Cの凍結温度で氷となり、100°Cの標準沸点で気化する。沸騰水より蒸気の潜熱は有意に高いことから、蒸気の形で気化した水は殺菌用に用いられる。

化学的性状：精製された水のpHは中性で、導電率及び有機体炭素 (TOC) は非常に低い。しかし、pH、導電率、有機体炭素 (TOC) は保存条件、空気中に気体として蒸発する水によって影響を受ける。大気中のCO₂に水が曝露されると水のpHが低下する。プラスチック容器に水を保存すると時間の経過とともに水中の有機体炭素が増加する。ガラス容器に保存した水は時間とともに水の電導率、pHが上昇することになる。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：注射<1>、医薬品用水<1231>、健康用途水<1230>、細菌エンドトキシン試験<85>、総有機体炭素<643>及び水の伝導度<645>

用途：賦形剤

概要：凍結乾燥医薬品に用いられる賦形剤又は充填剤には種々の糖類、糖アルコール、アミノ酸及び重合体が含まれている。充填剤の本質的な機能は破裂による薬物の損失を防ぎ、崩壊のない完全な構造のすばらしい製剤の凍結乾燥品を提供することにある。さらに、効率的な乾燥を促進するため、そして物理化学的に安定なマトリックス製剤を提供するために充填剤の選択を行う。機能を改善するために充填剤の補完的な併用がしばしば行われる。

マンニトールのような「良好な塊形成 (good cake forming)」と呼ばれる添加物は、凍結中に結晶化して効率的な乾燥がえられ、頑強な構造の塊が形成することから、しばしば用いられる。一部の有効成分では、凍結乾燥中に結晶化して安定性の改善に寄与する。従って、凍結乾燥中に結晶化を促進する充填剤の使用は重要である。この効果を得るためにアミノ酸と共溶媒が用いられる。バイオポリマーのほとんどの有効成分は凍結乾燥で非結晶質を保つため、二糖類のような充填剤は凍結や乾燥中の変質を防ぎ、安定な非結晶質相を維持する凍結保護剤として働く。不溶性で結晶質の有効成分の溶解度を向上させるためにバイオポリマーを時々使用して、溶解度の向上や凍結乾燥又はその後の再構成中における有効成分の結晶化を防ぐ。また、充填剤はバイオ適合性、緩衝能及び張性変更特性に基づいて選択する。

用途と機序：凍結乾燥中に迅速に結晶化する充填剤は最初の乾燥中に形成される塊 (ケーキ) の構造的な完全性維持に役立つ、その結果、肉眼的な崩壊や製剤的不具合を防ぐ。製剤における非結晶質成分の崩壊が顕微鏡的に認められる可能性 (いくつかの好ましくない結果の可能性) はあるが、充填剤の特性と濃度が適切であれば、肉眼的な崩壊は避けられる。また、充填剤は氷との高い共融液温度を持ち、迅速で効率的かつ均一的な乾燥を相対的に高い一次乾燥温度で可能にしなければならない。

凍結乾燥賦形剤 (換言すると凍結乾燥中に原薬を保護するもの) の凍結保護特性は一般的に高い粘度のガラス相を形成することで発現するため、精製白糖、トレハロース、特定のアミノ酸のような低分子量の非結晶質の単糖類をバイオポリマー原薬と一緒に入れる。一般的なたんぱく質医薬品製剤では、迅速に結晶化する糖アルコールと非結晶質賦形剤を混合する、この混合物は凍結保護剤として働く。

物理的性状：充填剤は凍結乾燥前に水性液で溶解する。従って、化学的純度、汚染微生物の存在及び発熱性物質 (ピロゲン) がバルク添加物にとって不可欠な特性となる。しかし、物理的性状及びバルク添加物の粒子の性状は一般的に凍結乾燥製剤の最終特性と関連性はみられない。

凍結乾燥中及びその後の製剤の特性に不可欠な物理的性状は、乾燥前の非結晶質凍結濃縮物のガラス相転移温度、最終乾燥製剤塊（ケーキ）のガラス転移温度、氷と結晶充填剤の共晶融液温度である。製剤のガラス相転移温度は個別の成分、濃度及び相互関連のガラス相転移温度に依存する。概算値は個々の成分に報告された転移温度に基づいて見積もることができるが、最新の実施方法は凍結乾燥顕微鏡の熱分析による製剤のガラス相転移温度測定である。

凍結乾燥中及びその後の充填剤の物理的状態は重要な物理的性状となる。製剤成分及び製造工程のパラメータは、いずれも充填剤が非結晶質となるか、特定の結晶質となるかを決定する役割をもつ。例えば、マンニトールは凍結乾燥中に容易に結晶化するにもかかわらず、製剤成分により非結晶質になることや水和物又は準安定多形として結晶化することもできる。凍結速度、乾燥温度、アニーリング（凍結融解）は製剤とその成分の物理的性状の管理に用いる製造工程の重要なパラメータである。また、凍結乾燥後の保湿及び吸着は、製剤の安定性及び特性の一因となる。

化学的性状：その他の処方成分、特に有効成分に関して充填剤の反応性は重要意味をもつ。糖を減量すると芳香族及び脂肪族アミンと反応をすることが良く知られている。グリコールは微量の過酸化値が含まれると酸化的分解反応が開始する。バイオポリマーと水素結合を形成する単糖類及び多価アルコールのできることは、その融解保護効果の役割を演じることである。

一般事項：次の一般事項は選択した賦形剤の特性を一定に確保するために有益となる：注射<1>、バイオテクノロジー応用品目<1045>、製剤処方、結晶化度<695>、溶液熱量測定法による結晶化度分布<696>、医薬品製剤形<1151>及び製剤系における水-固体相互作用<1241>

用途：等張化剤

概要：液剤の注射、点眼、又は点鼻を行った場合、異型赤血球（Crenation）や赤血球の溶血を避け、疼痛や不快感を緩和するために液剤は等張圧にしなければならない。このことは注射用液剤の実効浸透圧は血液の浸透圧と大体同じ状態であることを求めている。医薬品製剤は眼粘膜、鼻粘膜、膣粘膜等に投与される時、液剤はこれらの組織と等張にしなければならない。

用途と機序：緊張度（Tonicity）とは粘膜の浸透圧に及ぼす最大溶質濃度の合計に等しく、全体の浸透圧に影響する。透過性の溶質と非透過性の溶質の両方を考慮して、緊張度は浸透圧に対比する溶媒内の非透過性溶質にも適用する。例えば、尿素は透過性の溶質で細胞膜を自由に透過するため、液剤の緊張度を決めるときのファクターではない。対照的に塩化ナトリウム（NaCl）は非透過性で、濃度勾配の助けなくして粘膜を透過することができないため、液剤の緊張度に寄与する。

物理的性状：塩化ナトリウム、ブドウ糖液、乳酸リンゲル液は等張化剤を含む代表的な医薬品処方である。すべての液剤が緊張度に寄与するものではないが、一般的に溶質粒子の種類ではなく、溶質粒子数が影響を与える。例えば、モル対モルで塩化ナトリウム液は同じモル濃度のブドウ糖液より浸透圧は高い。これはブドウ糖が溶解するとき1粒子を保持しているが、塩化ナトリウムが溶解するときは、 Na^+ と Cl^- の2粒子となる。

化学的性状：等張化剤はイオン型、非イオン型で存在する。イオン型等張化剤の事例として、アルカリ金属や土類金属、塩化カルシウム、臭化カリウム、塩化カリウム、塩化リチウム、沃化ナトリウム、臭化ナトリウム、塩化ナトリウム、硫化ナトリウム、ホウ酸

などのハロゲン化物がある。非イオン型等張化剤にはグリセリン、ソルビトール、マンニトール、プロピレングリコール、デキストロース等が含まれる。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：**注射<1>**、**バイオテクノロジー応用品目<1045>**、**製剤処方**、**製剤形<1151>**及び**処方調剤における原薬の計算<1160>**

吸入剤

用途：噴射剤

概要：噴射剤は化合物で、常温状態で気体である。これらは医薬品（鼻腔内噴霧剤、吸入剤、外用剤）、化粧品及び食品で用いられ、容器から内容を強く噴射する。

用途と機序：噴射剤成分は低沸点の液体で、有効成分や添加物に対して相対的に不活性である。それら3つの特性は常温で実用的な圧力における液相の形成、製剤の残余との溶解度と混和性並びに引火性で特徴付けられる。これらの特性は、製剤の使用期間を通して想定内の適切な圧力を提供できる能力を判断する。

噴射剤は製剤で液相と気相の両方が存在する場合、液相に一定の圧力を与え、密封容器の上部空間の圧力で気相と液相を平衡状態に維持する。対照的に液相のない噴射剤の圧力は容器の内容物を放出して相対的に迅速な変化がみられる。密封容器の上部空間が大きくなると、それに比例して容器内の圧力は下がる。液相を持たないが、噴射剤以外の製剤と圧力に相関する有意な溶解度の噴射剤では、その2つのシステム間の特性が特徴となる。そのような場合、密閉容器の上部空間が増加すると噴射剤はシステムの圧力を維持するため液体から放出される。

定量吸入器では、噴射剤は液相で医薬品製剤を噴射する不可欠な成分である。絞り弁を作動させて、液体成分を一定の量で噴射させる。噴射剤は自然に沸騰、霧化して推進力を提供する。密閉容器の上部空間が増加すると噴射剤は液相からシステムの平衡圧力を回復するため気化し、活性濃度で想定内の変化を噴霧の最初から容器の最終使用時まで維持する。

物理的性状：噴射剤は常温未満で沸点となる。密度及び溶解度特性は噴射剤を選択するときに十分な検討を行う。アパフルラン (apafurane) 及びノルフルラン (norflurane) は液相密度が水より高い。炭化水素噴射剤 (ブタン、イソブテン、プロパン) 及びジメチルエーテルは液相密度が水より低い。

化学的性状：噴射剤は一般的に安定な物質で製剤の有効期限の長期化の一因となる。しかし、炭化水素噴射剤 (ブタン、イソブテン、プロパン) 及びジメチルエーテルは全て可燃性物質である。アパフルラン、二酸化炭素、窒素、ノルフルランは不燃性である。亜酸化窒素は可燃性ではないが、酸化を助ける。クロロフルオロカーボン噴射剤はオゾンを消耗する物質であることを考慮する。これを食品、医薬品、機器、化粧品に用いるには米国規制基準21 CFR 2.125で規制されている。クロロフルオロカーボン噴射剤で処方されているアルブテロール定量吸入器は2009年1月1日より米国では認められていない。

一般事項：次の一般事項は選択した添加物の特性を一定に確保するために有益となる：**エアゾール**、**鼻腔内噴霧器**、**定量吸入器及びドライパウダー吸入器<601>**、**クロマトグラフィー<621>**及び**水分測定<921>**

■2S (USP33)

追加情報：米国薬局方（USP）に問い合わせる前にFAQであなたの質問をチェックしてください。

題目/質問	問い合わせ先	専門家委員会
一般事項	Robert H. Lafaver, M.S. Scientific Liaison 1-301-816-8345	(EGC05) Excipient General Chapters

Pharmaceutical Forum: Volume No. 35(5) Page 1228

添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アジピン酸ジイソプロピル	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;ローション	20%	一般外用剤	120mg/g
局所;溶液	17%		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アスコルビン酸	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
筋肉注射	1%	筋肉内注射	1.68g
静脈	62.50%	静脈内注射	2.8g
静脈;パウダー;注射、注射溶液	0.20%		
静脈;パウダー;注射、注射溶液、凍結乾燥	0.09%		
静脈;注射、溶液	0.20%		
静脈(輸液);注射	50.40%	経口投与	500mg
経口;カプセル	7mg		
経口;濃縮物	0.60%		
経口;懸濁液	0.20%		
経口;シロップ	1.25%		
経口;錠剤	28.44mg		
経口;錠剤、フィルム被覆	20mg	皮下注射	10mg
皮下;注射	1%		
局所;ゲル	0.30%		
局所;溶液	0.04%	一般外用剤	1mg/g
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アセチルトリプトファン	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
静脈;注射	0.02%	静脈内注射	461mg
		アセチルトリプトファンナトリウム	
		静脈内注射	536.5mg
		皮下注射	215mg
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アセトン	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;ローション	10%	一般外用剤	392mg/g
局所;シャンプー	13%		
局所;溶液	12.69%		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アラビアゴム	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
頬/舌下;錠剤	9.1mg	舌下適用	9.6mg
		アラビアゴム末	
		舌下適用	460mg
経口;カプセル、徐効薬	11.77mg	経口投与	498mg
経口;パウダー	80%	経口投与	1800mg
経口;パウダー、経口用懸	64.80%		
経口;錠剤	70mg		
経口;錠剤(即時型/複合型リリース)、被覆されていない咀嚼剤	80mg		
経口;被覆錠剤	156mg		
経口;錠剤、徐放性、腸溶剤皮	10mg		
経口;錠剤、フィルム被覆	14.9mg		
経口;錠剤、反復作用錠	11.542mg		
経口;錠剤、徐効	34.4mg		
経口-20、錠剤	33.5mg		
経口-21、錠剤	5mg		
経口-28、錠剤	5mg		

添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アラントイン	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;乳剤、クリーム	1%	一般外用剤	1mg/g
局所;ゲル	0.20%		
膾;乳剤、クリーム	2%		
		アラントイン・dl-ピロリドンカルボン酸ナトリウム	
		一般外用剤	2mg/g
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アルギン酸	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
眼;座剤、挿入、コントロールリリース	1mg	眼科用剤	1mg/g
経口;カプセル	80mg	経口投与	984mg
経口;錠剤	32mg		
経口;錠剤(即時型/複合型リリース)、被覆されていない咀嚼剤	400mg		
経口;錠剤、被覆	60mg		
経口;錠剤、フィルム被覆	52.8mg		
経口;錠剤、徐効薬	22.25mg		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アルギン酸ナトリウム	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
経口;カプセル	80mg	経口投与	2.4g
経口;懸濁	0.12%		
経口;シロップ	0.30%		
経口;錠剤	20mg		
経口;錠剤(即時型/複合型リリース)、フィルム被覆	320mg		
経口;錠剤、コントロールリリース	262mg		
経口;錠剤、徐効	350mg		
経口;錠剤(即時型)、フィルム被覆	240mg		
経口;トローチ	64.309mg		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アルギン酸プロピレングリコールエステル	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
経口;粉末	50.25%	経口投与	360mg
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アルファチオグリセリン	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
筋肉内;注射	1%	筋肉内注射	25mg
静脈;注射	1%	静脈内注射	125mg
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アルブミン	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
経口;錠剤、フィルム被覆	4.5mg	経口投与、	2.6mg
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		アルモンド油	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;;乳剤、クリーム	2%	一般外用剤	525mg/g
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		安息香酸	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
伝染性単核球症一静注;注射	5%	静脈内注射	44mg
静注(輸液);注射	64.80%		
静注(輸液);注射	64.80%		
筋肉;溶液、注射	0.20%	筋肉内注射	44mg
経口;濃縮物	1.25%	経口投与	80mg
経口;溶液	0.50%		
経口;溶液、エリキシル	0.50%		

経口 ; 懸濁	0.10%	経口投与	80mg
経口 ; シロップ	0.753%		
直腸 ; ゲル	0.14%	直腸腔尿道適用	1mg、/g
直腸 ; 懸濁	0.10%		
腔 ; 乳剤、クリーム	0.25%		
腔 ; スポンジ	3mg		
局所 ; 乳剤、クリーム	0.25%	一般外用剤	4mg/g
局所 ; ゲル	0.10%		
局所 ; ローション	0.20%		
局所 ; 溶液	0.10%		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		安息香酸ナトリウム	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
歯科 ; ゲル	0.08%	歯科外用及び口中用	0.7mg/g
伝染性単核球症—静注 ; 注射	10%	静脈内注射	40mg (点滴)
静脈 ; 注射	0.07%		
静注 (輸液) ; 注射	5%		
筋肉内 ; 注射	5%	筋肉内注射	20mg
筋肉内 ; 溶液、注射	4.80%		
経口 ; カプセル	0.3mg	経口投与	2200mg
経口 ; カプセル、硬化ゼラチン	0.11mg		
経口 ; 濃縮	0.20%		
経口 ; ドロップ	0.30%		
経口 ; 懸濁用	10mg		
経口 ; 細粒、FOR 再形成	10mg		
経口 ; 細粒、懸濁用	10mg		
経口 ; 液体	0.50%		
経口 ; 粉体、懸濁用	3.60%		
経口 ; 粉体、FOR 再形成	0.10%		
経口 ; 粉体、溶液	9.33%		
経口 ; 粉体、懸濁用	8%		
経口 ; 溶液	1.08%		
経口 ; 溶液、エリキシル	0.50%		
経口 ; 粉体、液体	0.10%		
経口 ; 懸濁	3.79%		
経口 ; 懸濁、ドロップ	0.24%		
経口 ; 懸濁、液体	0.20%		
経口 ; シロップ	5%		
経口 ; 錠剤	0.75mg		
経口 ; 錠剤 (即時型/複合型リリース) 被覆なし、起泡	60mg		
経口 ; 錠剤、被覆	9mg		
経口 ; 錠剤、徐法性、腸溶性被覆	0.34mg		
経口 ; 錠剤、フィルム被	0.02mg		
経口 ; 錠剤、溶液用	5mg		
直腸 ; かん腸	0.10%	注腸	1560mg
直腸 ; ゲル			
局所 ; 乳剤		一般外用剤	5mg/g
局所 ; 乳剤、クリーム	0.20%		
局所 ; 貼付	0.44mg		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		安息香酸ベンジル	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
筋肉内 ; 注射可能	20%	筋肉内注射	371mg、
筋肉内 ; 注射	46%		
筋肉内 ; 溶液、注射	15%		

経口;カプセル	0.6084mL	経口投与	5.6mg
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		イソステアリルアルコール	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;乳剤、クリーム	3%	一般外用剤	30mg/g
局所;ローション	25%		
局所;懸濁	2.50%		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		イソステアリン酸	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;乳剤、クリーム	25%	一般外用剤	60mg/g
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		ラノリンアルコール	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;乳剤、クリーム	6%	一般外用剤	200mg/g
局所;軟膏	3.01%		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		ココアミドジエタノールアミン	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;エアゾール、定量式	3%	ヤシ油脂肪酸ジエタノールアミド	
局所;乳剤、クリーム	4%	一般外用剤	40mg/g
局所;シャンプー	3.50%		
局所;溶液	4%		
局所;スポンジ	20.2mg		
局所;懸濁	4%		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		ジエタノールアミン	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
静脈(輸液);注射	1.50%	静脈内注射	12mg
局所;乳剤、クリーム	0.30%	一般外用剤	19mg/g
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		フェノキシエタノール	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;;クリーム、増強	0.50%	一般外用剤	1.2mg/g
局所;乳剤、クリーム	0.50%		
局所;ゲル	0.70%		
局所;ローション	0.70%		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		カルボキシメチルセルロース	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
		カルメロース	
経口;;懸濁	6.40%	経口投与	950mg
経口;錠剤	3mg		
経口;カプセル	70mg		
局所L;貼付	6.14mg	一般外用剤	24mg/g
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		カルボキシメチルセルロース カルシウム	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
経口;カプセル、ハードゼラチン	36mg	カルメロースカルシウム	
経口;錠剤	29mg	経口投与	2.5g、
経口;錠剤、徐法性、腸溶性被覆	13.3mg		
経口;錠剤、フィルム被覆	241.842mg		
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)		カルボキシメチルセルロース ナトリウム	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
歯科、ジェル	0.40%	カルメロースナトリウム	
歯科、ペースト	174mg	歯科外用及び口中用	99.7mg/g
関節内;注射	0.50%	その他の注射	30mg
滑液嚢内;注射	0.10%		
軟組織;注射	0.50%	筋肉内注射	50mg
筋肉内;注射	3%		
筋肉内;注射、微小球状体	1%		

筋肉内; 粉末, 注射 溶液 用, 凍結乾燥	3%	筋肉内注射	50mg		
鼻; スプレー, 定量式	0.15%	吸入剤	5mg/mL		
経口; カプセル	160mg	経口投与	4.3g		
経口; カプセル 腸溶性 被 覆 粒剤	4.2mg				
経口; カプセル, 徐効性	0.469mg				
経口; ドロップ	0.51%				
経口; 細粒	25.7mg				
経口; 細粒, 懸濁用					
経口; 粉末, 溶液用	0.26%				
経口; 粉末, 懸濁用	2%				
経口; 溶液	3.50%				
経口; 懸濁	3.75%				
経口; 懸濁, ドロップ	0.10%				
経口; シロップ	2.65%				
経口; 錠剤	48mg				
経口; 錠剤 (即時型/複合 型リリース) 被覆なし, 咀嚼	24.75mg				
経口; 錠剤, 被覆	2.2mg				
経口; 錠剤, 持続放出	15mg				
経口; 錠剤, フィルム被覆	50mg				
経口; 錠剤, 徐効性	155mg				
局所; ジェル	35mg			一般外用剤	60mg/g
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)				エチルセルロース	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量		
経口; カプセル	6mg	経口投与	489mg		
経口; カプセル 持続放出	21.887mg				
経口; カプセル, 徐効性	39.2mg				
経口; カプセル 徐効性, ハードジェルATIN	27.04mg				
経口; 微粒, 懸濁用	85mg				
経口; 錠剤	120.8mg				
経口; 錠剤 (即時型/複合 型リリース) 被覆なし, 咀嚼	8.8mg				
経口; 錠剤, 被覆	20mg				
経口; 錠剤, 徐効性, 腸溶 性 被覆	53.8mg				
経口; 錠剤, 持続放出	80mg				
経口; 錠剤 フィルム被覆	83mg				
経口; 錠剤, 経口LY 崩壊	17.46mg				
経口; 錠剤, 徐効性	308.8mg				
経口; 錠剤, 徐効性, 被覆	15.15mg				
経口; 錠剤, 徐効性, フィル ム被覆	52.5mg				
経口-28; 錠剤	1.05mg				
局所; 貼付	2.53mg			一般外用剤	2mg/mL
経皮; フィルム, コントロー ルリリース	80.4mg				
添加物 (INACTIVE INGREDIENT)				ヒドロキシプロピル メチルセルロース 2208	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量			日本の投与経路	日本の投与量
頬; 錠剤	2.25mg	ヒプロメロース			
眼; 溶液, ドロップ	0.50%	眼科用剤	3.5mg/g		
経口; カプセル	3.5mg	経口投与	480mg		
経口L; 微粒, 腸溶性 被覆	33.2mg				
経口; 錠剤	50mg				

経口;錠剤,持続放出	17mg	経口投与	480mg
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ヒドロキシプロピル メチルセルロース 2910	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
眼;溶液	0.50%	ヒプロメロース	
眼;懸濁	0.50%	眼科用剤	3mg/g
眼;懸濁,ドロップ	0.50%		
経口;カプセル	40.5519mg	経口投与	1g
経口;カプセル 徐法性	33.42mg		
経口;カプセル,腸溶性 被覆 粒剤	13.82mg		
経口;カプセル,持続放出	3.78mg		
経口;カプセル,ハードゼラチン	2mg		
経口;カプセル,徐効性	10.88mg		
経口;カプセル,徐効性,ハードゼラチン	4.772mg		
経口;粉末,FOR再形成	1.59%		
経口;粉末 懸濁用	3%		
経口;懸濁	0.50%		
経口;シロップ	0.45%		
経口;錠剤	54mg		
経口;錠剤(即時型/複合型リリース),フィルム被覆	16.76mg		
経口;錠剤(即時型/複合型リリース),被覆なし,咀嚼	11.8mg		
経口;錠剤,被覆	7.5mg		
経口;錠剤,コントロールリリース	20mg		
経口;錠剤徐法性,腸溶性被覆	19mg		
経口;錠剤,腸溶性 被覆 砂粒	445mg		
経口;錠剤,持続放出	150mg		
経口;錠剤,フィルム被覆	60mg		
経口;錠剤,多層,被覆	22mg		
経口;錠剤,経口LY崩壊性,除法性	7mg		
経口;錠剤,徐効性	250mg		
経口;錠剤,徐効性,被覆	6mg		
経口;錠剤,徐効性,フィルム被覆	54mg		
経口-21;錠剤	0.75mg		
経口-28;錠剤	0.75mg		
経口;カプセル,徐効性	100.4mg		
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ヒドロキシプロピル メチルセルロース 酢酸 コハク酸	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
経口;カプセル	44.6mg	経口投与	366mg
経口;カプセル 徐法性	66.78mg		
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ヒドロキシプロピル メチルセルロース フタル酸	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
経口;カプセル	16.8mg	ヒプロメロースフタル酸エステル 200731タイプ	
経口;カプセル,被覆ペ	13.26mg	経口投与	504mg
経口;カプセル,腸溶性 被覆 粒剤	76.4mg	ヒプロメロースフタル酸エステル 220824タイプ	
経口;カプセル,徐効性	19.63mg	経口投与	175mg
経口;細粒,懸濁用	302.4mg		

経口;錠剤	65mg	経口投与	175mg
経口;錠剤徐法性,腸溶性被覆	44.57mg		
経口;錠剤,腸溶性被覆砂粒	119.4mg		
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		メチルセルロース	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
類/舌下;錠剤	4mg	舌下適用	8mg
眼;溶液	0.16%	眼科用剤	5mg/g
経口;カプセル	13.5mg	経口投与	607.5mg
経口;カプセル,持続放出	2.67mg		
経口;カプセル,徐効性	3.2mg		
経口;粉末,懸濁用	1.19%		
経口;懸濁	0.03%		
経口;錠剤	183.6mg		
経口;錠剤(即時型/複合型リリース)、被覆されていない咀嚼剤	50mg		
経口;錠剤,被覆	138.3mg		
経口;錠剤,フィルム被覆	21mg		
経口;錠剤,徐効性	96mg		
経口-28;錠剤	15mg		
局所;乳剤,クリーム	1.30%	一般外用剤	70mg/g
局所;ローション	1.50%		
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ポリエチレングリコール1000(マクロゴール1000)	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;乳剤,エアゾール、フォーム		一般外用剤	2mg/g
局所;乳剤,クリーム	7.20%		
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ポリエチレングリコール1500(マクロゴール1500)	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;軟膏	5%	一般外用剤	765mg/g
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ポリエチレングリコール1540(マクロゴール1540)	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
経口;溶液	3.36%	経口投与	2mg
局所;軟膏	38%	一般外用剤	248mg/g
局所;溶液	29.70%		
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ポリエチレングリコール200(マクロゴール200)	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
局所;軟膏	39%	一般外用剤	200mg/g
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ポリエチレングリコール20000(マクロゴール20000)	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
経口;カプセル	18mg	経口投与	23.2mg
経口;カプセル,ハードゼラチン	13.5mg		
経口;錠剤	0.3mg		
経口;錠剤,徐法性,腸溶性被覆	0.008mg		
経口-28;錠剤	0.3mg		
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ポリエチレングリコール300(マクロゴール300)	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
静脈;注射	65%	静脈内注射	4875mg/体表面積m ²
静注(輸液);注射	65%		
経口;錠剤	1mg	経口投与	20mg
経口;錠剤,フィルム被覆	1.5mg		
局所;軟膏	57%	一般外用剤	450mg/g

局所L; 溶液	29.70%	一般外用剤	450mg/g
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ポリエチレングリコール3500(マクロゴール3500)	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
経口; 錠剤, フィルム被覆		経口投与	20.5mg
添加物(INACTIVE INGREDIENT)		ポリエチレングリコール400(マクロゴール400)	
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
伝染性単核球症- 静注; 注射	20.30%	静脈内注射	3.2g
伝染性単核球症- 静注; 溶液, 注射	18%		
静脈; 注射	11.25%		
静注(輸液); 注射	11.25%		
経口; カプセル	500mg	経口投与	2.31g
経口; カプセル, 被覆, ソフトゼラチン	103.55mg		
経口; カプセル, 持続放出	1.7mg		
経口; カプセル, ソフトゼラチン	960.78mg		
経口; カプセル, 徐効性, ハードゼラチン	1.7mg		
経口; 濃縮	60%		
経口; 溶液	60%		
経口; 懸濁	5%		
経口; シロップ	0.05%		
経口; 錠剤	105.065mg		
経口; 錠剤(即時型/複合型リリース), フィルム被覆	20mg		
経口; 錠剤, 腸溶性 被覆砂粒	12.5mg		
経口; 錠剤, 持続放出	45mg		
経口; 錠剤, フィルム被覆	5.91mg		
経口; 錠剤, 徐効性	45mg		
経口; 錠剤, 徐効性, フィルム被覆	1.8mg		
経口-21; 錠剤	0.15mg		
経口-28; 錠剤	0.15mg		
局所; 乳剤, クリーム	7.50%	一般外用剤	700mg/g
局所; ジェル	45%		
局所; ローション	12%		
局所; 軟膏	65%		
局所; 溶液	69.90%		
添加物(INACTIVE INGREDIENT)			
アメリカの投与経路/剤型	アメリカの投与量	日本の投与経路	日本の投与量
関節内; 注射	3%	静脈内注射	120mg
病巣内; 注射	3%	筋肉内注射	180mg
筋肉内; 注射	3%	皮下注射	40mg
滑液嚢内; 注射	3%	その他の注射	60mg
経口; カプセル	449.6mg	経口投与	1206mg
経口; カプセル, ソフトゼラチン	15mg		
経口; 錠剤	15mg		
経口; 錠剤, 被覆	2mg		
経口; 錠剤, 徐効性, 腸溶性 被覆	0.96mg		
経口; 錠剤, 持続放出	45mg		
経口; 錠剤, フィルム被覆	1.625mg		