

事務連絡

平成 29 年 12 月 13 日

各

都道府県
保健所設置市
特別区

 衛生主管部(局)薬務主管課 御中

厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課

(公印省略)

「デスカルボンシルデナフィル」の医薬品成分該当性について

今般、東京都からの疑義照会に対し、別添のとおり回答しましたのでお知らせします。



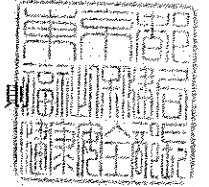


29 福保健薬第1820号
平成29年8月15日

厚生労働省医薬・生活衛生局
監視指導・麻薬対策課長 殿

東京都福祉保健局健康安全部長

高橋 博



医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する
法律に関する疑義について（照会）

標記の件について、下記のとおり疑義が生じたので、照会します。

記

人が経口的に服用するものについて、デスカルボンシルデナフィル（化学名：
N-[2-(dimethylamino)ethyl]-4-ethoxy-3-(1-methyl-7-oxo-3-propyl-6,7-dihydro-1H-pyrazolo[4,3-d]p
yrimidin-5-yl)benzenesulfonamide) なる成分本質（原材料）は、昭和46年6月1日付薬発第476
号厚生省薬務局長通知「無承認無許可医薬品の指導取締りについて」の成分本質の分類上、「専ら医薬
品として使用される成分本質」に該当すると判断して差し支えないか。

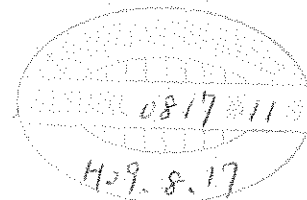
（添付資料）デスカルボンシルデナフィルに関する資料

担当

東京都福祉保健局健康安全部

薬務課監視指導担当

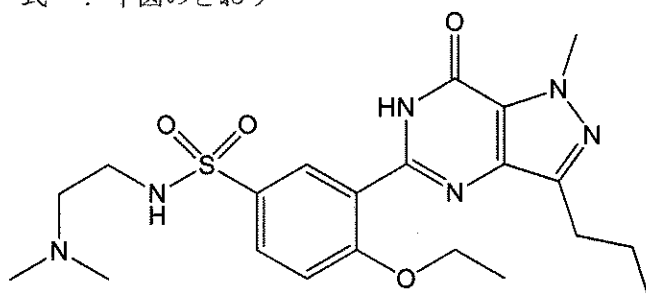
TEL03-5320-4512



デスカルボンシルденаフィルの分析法

1 使用した標準品

販売名 : Sildenafil Related Compound (PDE-5 Inhibitor)
購入先 : TLC Pharmaceutical Standards Ltd.
CAS No. : 1393816-99-3
化学式 : $C_{21}H_{30}N_6O_4S$
分子量 : 462.57
IUPAC名 : *N*-[2-(dimethylamino)ethyl]-4-ethoxy-3-(1-methyl-7-oxo-3-propyl-6,7-dihydro-1H-pyrazolo[4,3-d]pyrimidin-5-yl)benzenesulfonamide
別名 : Descarbonsildenafil
製品番号 : S-0624
構造式 : 下図のとおり



2 LC/PDA

(1) 試料溶液

試料粉末約 25mg にメタノール 20mL を加え、超音波下 10 分間抽出を行い、15 分間振とうする。次いで遠心分離 (3000rpm、10 分間) を行い、上澄液をメタノールで全量 25mL とし、これを試料原液とする。この試料原液またはこれを適宜希釈したものについて、膜ろ過を行い試料溶液とする。

(2) 標準溶液

標準品について、メタノールで希釈したものを標準溶液とする。

(3) 分析機器

ACQUITY UPLC (Waters 製)

(4) LC 条件

カラム : ACQUITY UPLC HSS C18 (2.1×150 mm、1.8 μm)
カラム温度 : 50°C
流速 : 0.4mL/min
検出 : PDA (210-450nm)
移動相 : A液 5mM ヘキサンスルホン酸ナトリウム含有 アセトニトリル/水/リン酸(100:900:1)
B液 5mM ヘキサンスルホン酸ナトリウム含有 アセトニトリル/水/リン酸(900:100:1)
0 → 0.5 分 A液 91.5%
0.5 → 10 分 A液 91.5% → 5.3%
10 → 12.25 分 A液 5.3%

(5) 結果

別紙1のとおり

3 LC/MS

(1) 試料溶液

2 (1) に記載したとおり

(2) 標準溶液

2 (2) に記載したとおり

(3) 分析機器

ACQUITY TQD (Waters 製)

(4) LC 条件

カラム : ACQUITY UPLC HSS C18 (2.1×150 mm、1.8 μm)

カラム温度 : 50°C

流速 : 0.4mL/min

移動相 : A液 5mM キ酸アンモニウム(キ酸で pH3 に調整) : 0.1% キ酸含有アセトリル=95 : 5

B液 0.1% キ酸含有アセトリル

0 →0.5分 A液 91.5%

0.5→10分 A液 91.5%→5.3%

10 →12.25分 A液 5.3%

(5) MS 条件

キャピラリー : 3 kV

Rf レンズ : 0.1 V

ソース温度 : 120°C

デソルベーション温度 : 350°C

コーンガス : 50 L/hr

デソルベーションガス : 600 L/hr

コーン電圧 : ESI+20 V、95 V

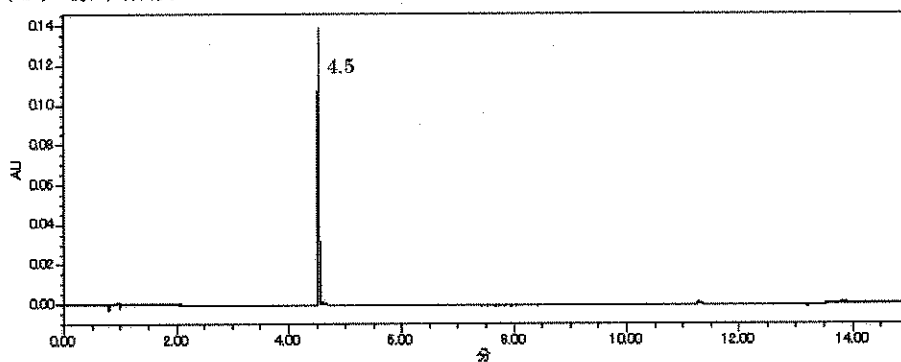
マスレンジ : m/z 50~650

(6) 結果

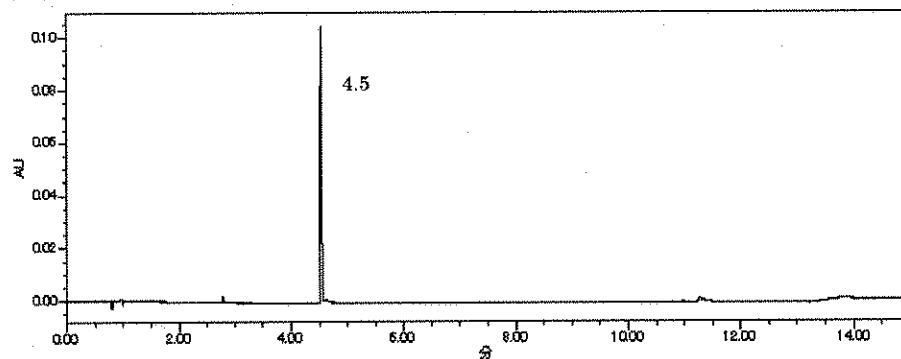
別紙2のとおり

1 LCクロマトグラム

(1) 標準溶液

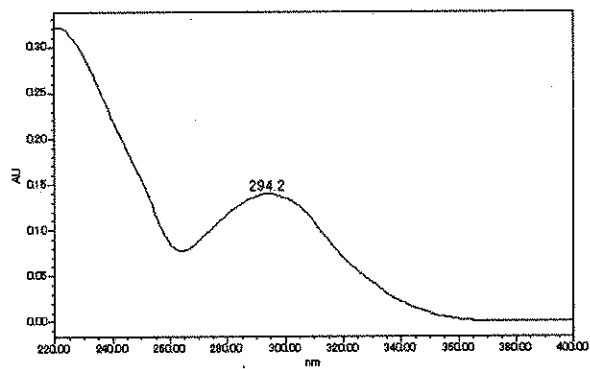


(2) 試料溶液

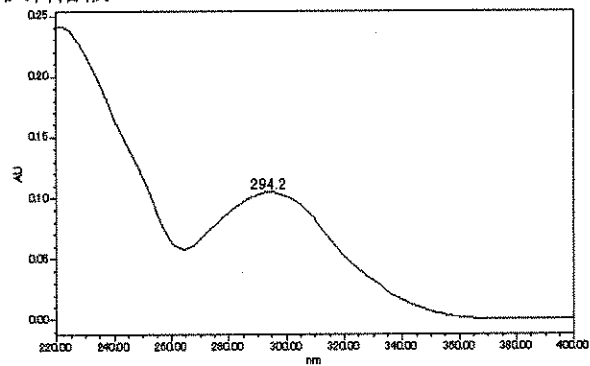


2 UVスペクトル

(1) 標準溶液

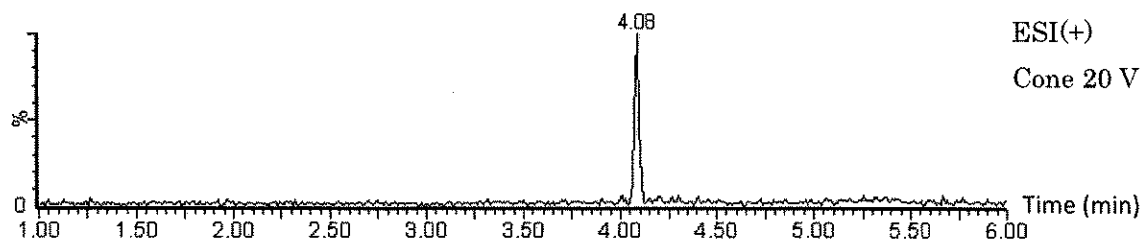


(2) 試料溶液

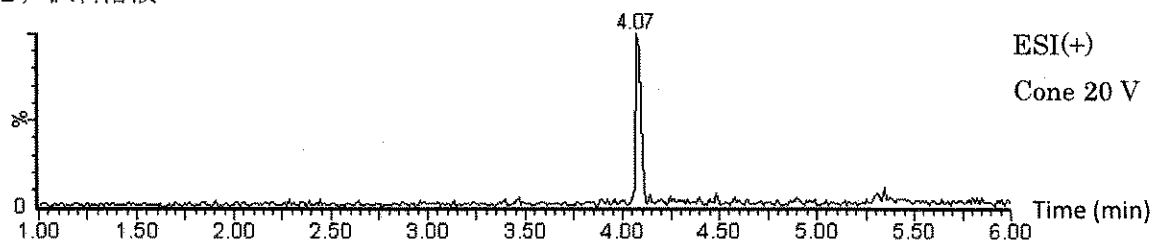


2 トータルイオンクロマトグラム (TIC)

(1) 標準溶液

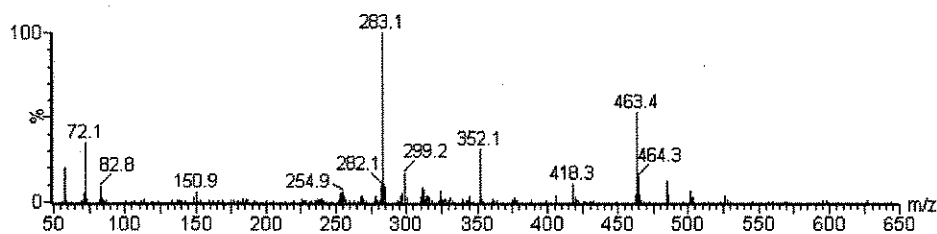
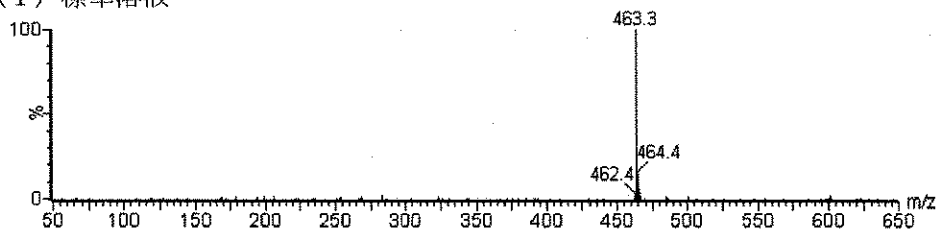


(2) 試料溶液

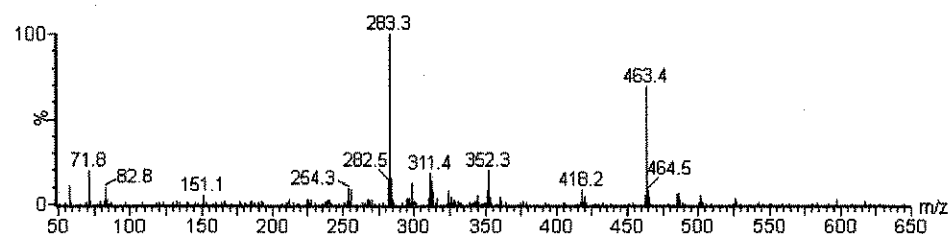
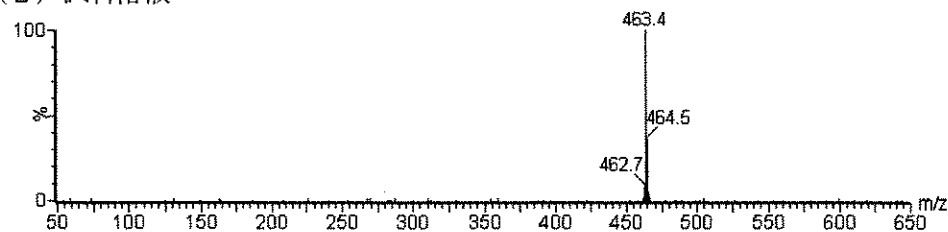


2 MS スペクトル

(1) 標準溶液



(2) 試料溶液



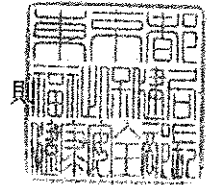


29 福保健薬第 2809 号
平成 29 年 11 月 1 日

厚生労働省医薬・生活衛生局
監視指導・麻薬対策課長 殿

東京都福祉保健局健康安全部長

高 橋 博



医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する
法律に関する疑義について（照会）

平成 29 年 8 月 15 日付 29 福保健薬第 1820 号にて、標記の件について下記のとおり照会したところ
であるが、別添のとおり追加資料を送付する。

記

人が経口的に服用するものについて、デスカルボンシルデナフィル（化学名：
N-[2-(dimethylamino)ethyl]-4-ethoxy-3-(1-methyl-7-oxo-3-propyl-6,7-dihydro-1H-pyrazolo[4,3-d]p
yrimidin-5-yl)benzenesulfonamide) なる成分本質（原材料）は、昭和 46 年 6 月 1 日付薬発第 476
号厚生省薬務局長通知「無承認無許可医薬品の指導取締りについて」の成分本質の分類上、「専ら医薬
品として使用される成分本質」に該当すると判断して差し支えないか。

（別添）デスカルボンシルデナフィルのホスホジエステラーゼ 5 阻害活性に関する資料

担当

東京都福祉保健局健康安全部
薬務課監視指導担当

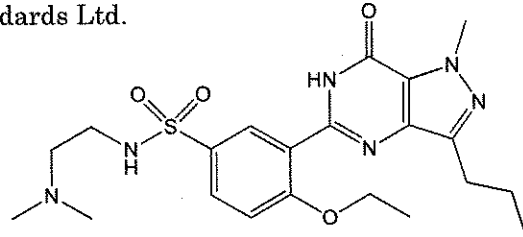
TEL 03-5320-4512

デスカルボンシルденаフィルのホスホジエステラーゼ5阻害活性に関する資料

1 使用した標準品

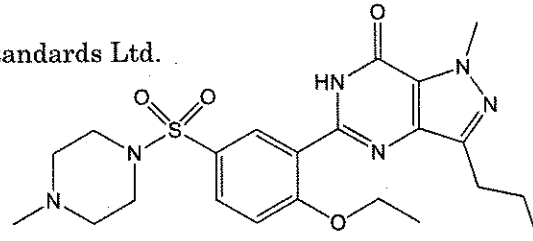
(1) デスカルボンシルденаフィル

販売名 : Sildenafil Related Compound (PDE-5 Inhibitor)
 購入先 : TLC Pharmaceutical Standards Ltd.
 CAS No. : 1393816-99-3
 化学式 : $C_{21}H_{30}N_6O_4S$
 分子量 : 462.57
 別名 : Descarbonsildenafil
 製品番号 : S-0624
 構造式 : 右図のとおり



(2) シルденаフィルクエン酸塩

販売名 : Sildenafil Citrate
 購入先 : TLC Pharmaceutical Standards Ltd.
 CAS No. : 171599-83-0
 化学式 : $C_{22}H_{30}N_6O_4S \cdot C_6H_8O_7$
 分子量 : 474.59 · 192.13
 製品番号 : S-061
 構造式 : 右図のとおり



• $C(OH)(CH_2COOH)_2COOH$

2 方法

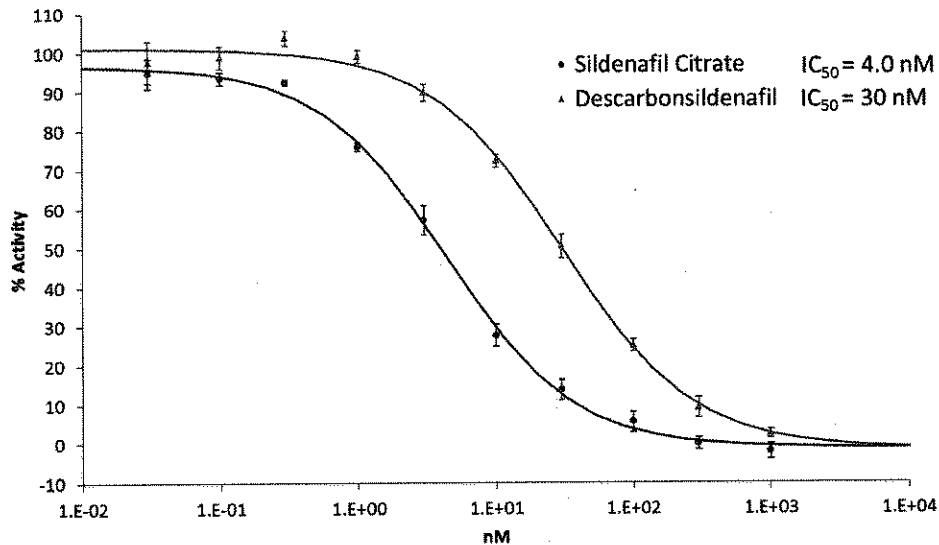
標準品を最終濃度 0.03~1000 nM となるように調製した溶液について、PDE5A1 Assay Kit (BPS Bioscience 製)を用い、反応させた後の蛍光偏光を測定する。

3 分析機器

SpectraMax Paradigm、蛍光偏光測定カートリッジ (Ex 485 nm, Em 535 nm, Fluorescein)
 (ともに Molecular Devices 製)

4 結果

下図のとおり





薬生監麻発 1213 第 1 号

平成 29 年 12 月 13 日

東京都福祉保健局健康安全部長

高橋 博則 様

厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課長

(公 印 省 略)

医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する
法律に関する疑義について (回答)

平成 29 年 8 月 15 日付 29 福保健薬第 1820 号をもって照会のあった標記の件について、
下記のとおり回答する。

記

貴見のとおりと解する。

