

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2021. 12. 03 第 3 版（2018. 4. 25 初版）

有効成分	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 75mg 「オーハラ」	大原薬品工業
	2	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 75mg 「サワイ」	沢井製薬
	3	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 37.5mg 「オーハラ」	大原薬品工業
	4	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 37.5mg 「サワイ」	沢井製薬
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	アルタットカプセル 75mg	あすか製薬
	②	アルタットカプセル 37.5mg	あすか製薬
効能・効果	http://www.bbdb.jp		
用法・用量	http://www.bbdb.jp		
添加物	http://www.bbdb.jp		
解離定数 ¹⁾	pKa : 9.3（滴定法）		
溶解度 ¹⁾ (37°C)	pH1.2 : 2.20g/mL pH4.0 : 2.11g/mL pH6.8 : 2.15g/mL 水 : 2.11g/mL		
原薬の安定性 ¹⁾	水	37°C、24 時間で約 1%分解する。	
	液性 (pH)	pH1.2、37°C、3 時間で約 15%分解する。 pH4.0 及び pH6.8、37°C、24 時間で、それぞれ約 1%及び約 8%分解する。	
	光	なし	
	その他	なし	
膜透過性	なし		
BCS・Biowaiver option	なし		
薬効分類	232 消化性潰瘍用剤		
規格単位	37.5mg 1カプセル 75mg 1カプセル		

【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	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「オーハラ」	大原薬品工業	○			
2	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」	沢井製薬	○			
3	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「オーハラ」	大原薬品工業	○			
4	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」	沢井製薬	○			

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。【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²⁾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】

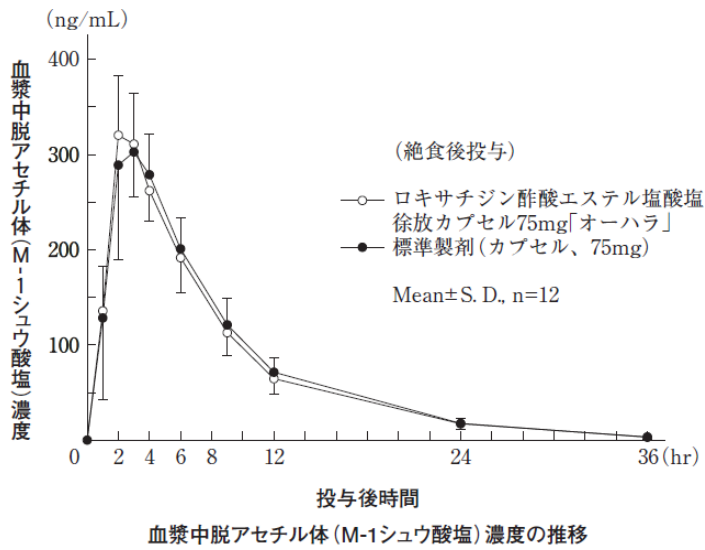
注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【7 ページ】

注) 大原薬品工業及び沢井製薬のカプセル 37.5mg は、承認時において他社と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）。

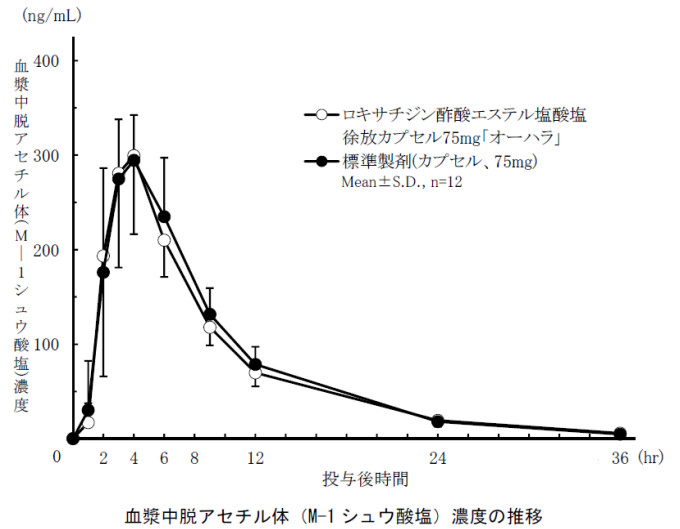
【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1

絶食後投与

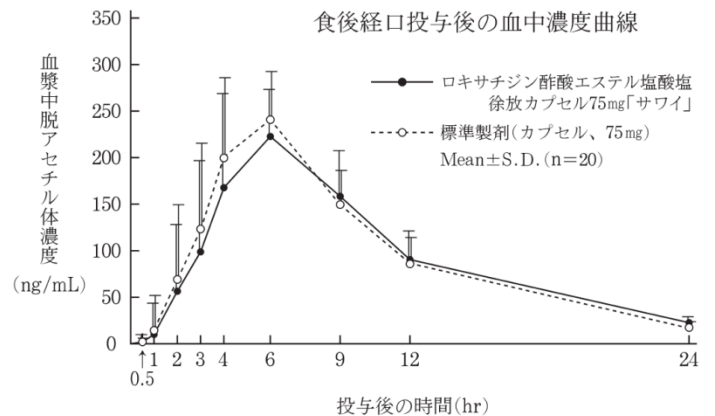
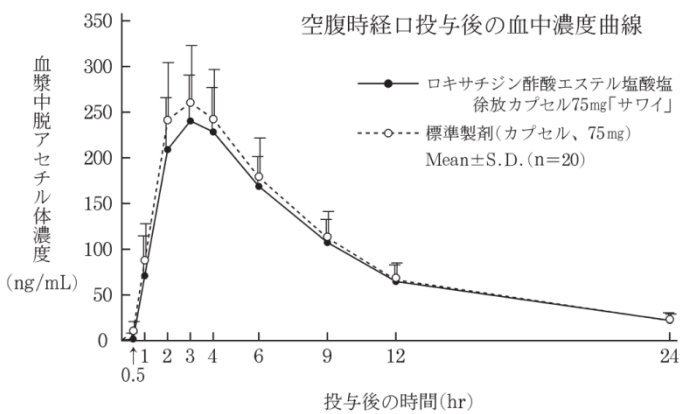


食後投与



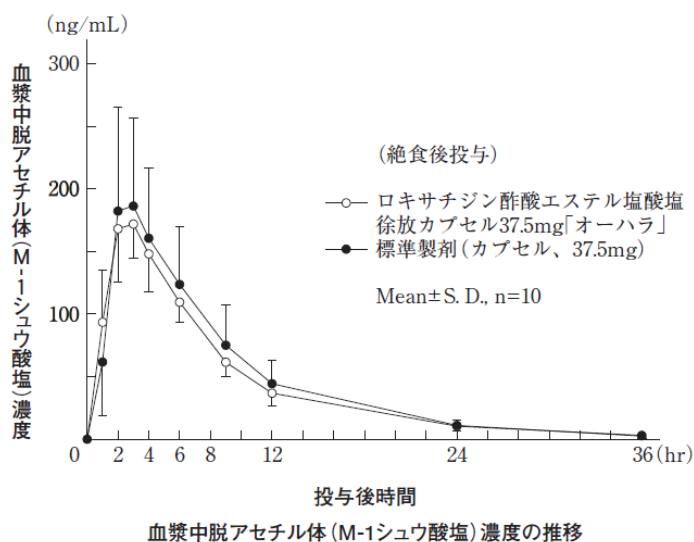
(右図はインタビューフォームより)

2

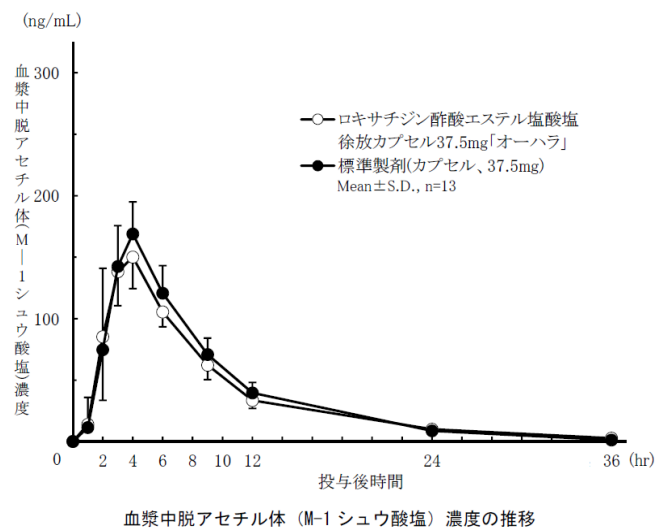


3

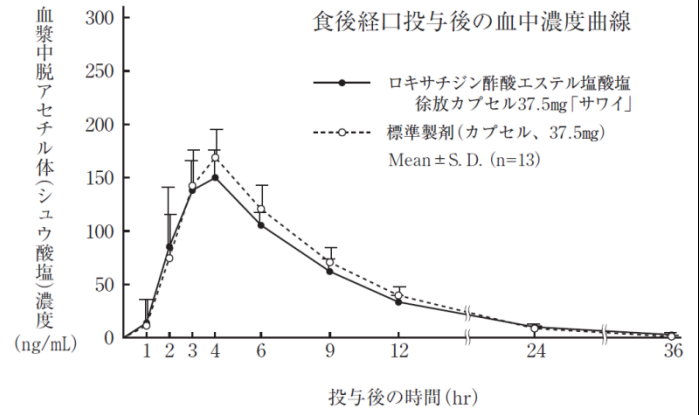
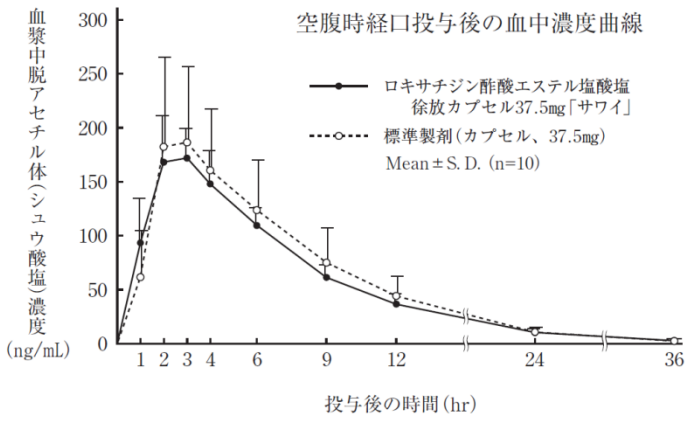
絶食後投与



食後投与



(右図はインタビューフォームより)



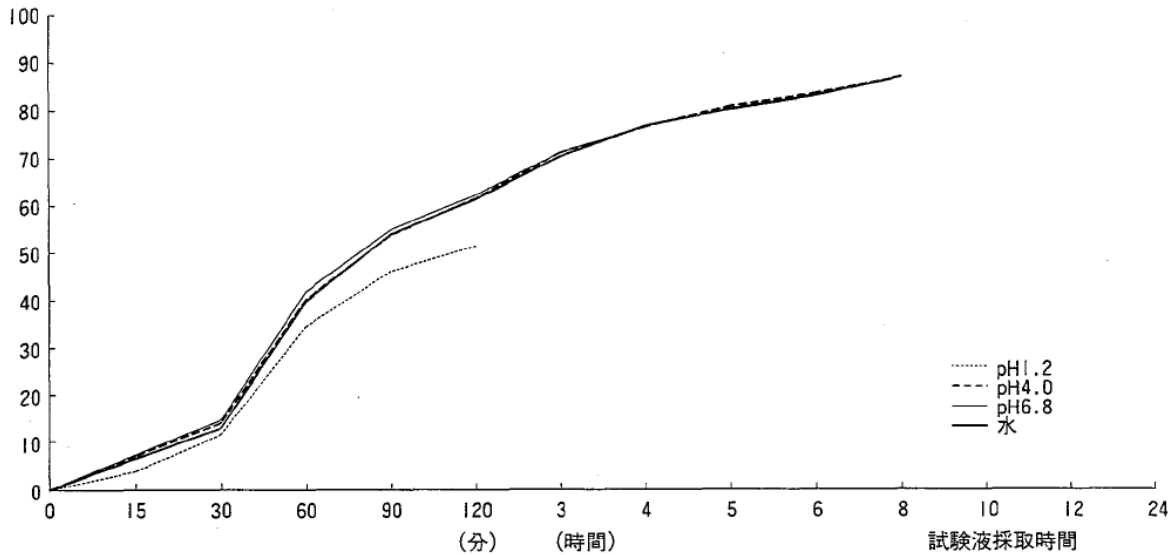
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

塩酸ロキサチジンアセタート徐放カプセル37.5mg

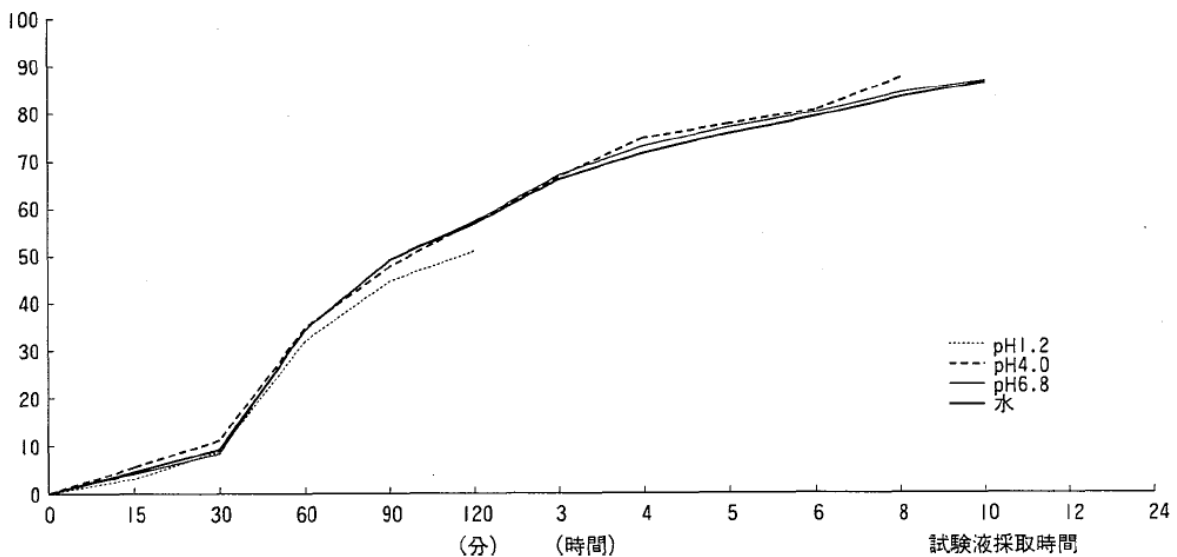
- 溶出率(%)
1. 有効成分名：塩酸ロキサチジンアセタート
 2. 剤形：徐放カプセル
 3. 含量：37.5mg
 4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
 5. 回転数：50rpm
 6. 界面活性剤：使用せず



溶出曲線測定例

塩酸ロキサチジンアセタート徐放カプセル75mg

- 溶出率(%)
1. 有効成分名：塩酸ロキサチジンアセタート
 2. 剤形：徐放カプセル
 3. 含量：75mg
 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】

なし

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル
Roxatidine Acetate Hydrochloride Extended-release Capsules

溶出性 〈6.10〉 試験液に水 900mL を用い、パドル法(ただし、シンカーを用いる)により、毎分 50 回転で試験を行うとき、37.5mg カプセルの 45 分間、90 分間及び 8 時間の溶出率はそれぞれ 10~40%、35~65%及び 70% 以上であり、75mg カプセルの 60 分間、90 分間及び 8 時間の溶出率はそれぞれ 20~50%、35~65%及び 70% 以上である。

本品 1 個をとり、試験を開始し、規定された時間にそれぞれ溶出液 20mL を正確にとり、直ちに 37±0.5℃に加温した水 20mL を正確に注意して補う。溶出液は孔径 0.45 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 1mL を正確に量り、1mL 中にロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 (C₁₉H₂₈N₂O₄・HCl) 約 42 μg を含む液となるように試験液を加えて正確に V' mL とし、試料溶液とする。別にロキサチジン酢酸エステル塩酸塩標準品をデシケーター(減圧、酸化リン(V))で 4 時間乾燥し、その約 21mg を精密に量り、水に溶かし、正確に 50mL とする。この液 2mL を正確に量り、水を加えて正確に 20mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 100 μL 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、それぞれの液のロキサチジン酢酸エステルのピーク面積 A_{T(n)}及び A_Sを測定する。

n 回目の溶出液採取時におけるロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 (C₁₉H₂₈N₂O₄・HCl) の表示量に対する溶出率 (%) (n=1, 2, 3)

$$= M_S \times \left\{ \frac{A_{T(n)}}{A_S} + \sum_{i=1}^{n-1} \left(\frac{A_{T(i)}}{A_S} \times \frac{1}{45} \right) \right\} \times \frac{V'}{V} \times \frac{1}{C} \times 180$$

M_S: ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩標準品の秤取量 (mg)

C: 1 カプセル中のロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 (C₁₉H₂₈N₂O₄・HCl) の表示量 (mg)

試験条件

検出器: 紫外吸光光度計(測定波長: 274nm)

カラム: 内径 4.6mm, 長さ 15cm のステンレス管に 5 μm 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: 40℃付近の一定温度

移動相: 水/アセトニトリル/トリエチルアミン/酢酸(100)混液(340:60:2:1)

流量: ロキサチジン酢酸エステルの保持時間が約 5 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 μL につき、上記の条件で操作するとき、ロキサチジン酢酸エステルのピークの理論段数及びシンメトリー係数は、それぞれ 3000 段以上、2.0 以下である。

システムの再現性: 標準溶液 100 μL につき、上記の条件で試験を 6 回繰り返すとき、ロキサチジン酢酸エステルのピーク面積の相対標準偏差は 1.0% 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13年7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13年度（その2）について（平成13年7月3日付け医薬発第715号、厚生労働省医薬局長）
- 3) 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）