ラスビック錠 75mg

(ラスクフロキサシン塩酸塩)

第 2 部　CTD の概要(サマリー)

2.3　品質に関する概括資料

杏林製薬株式会社

2.3.S　原薬*

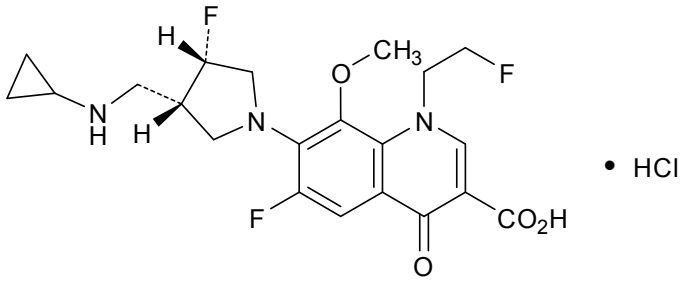
1.　名称

ラスクフロキサシン塩酸塩

国際一般名(rINN)　：lascufloxacin
日本医薬品一般名称(JAN)　：ラスクフロキサシン塩酸塩
化学名　：7-{(3*S*,4*S*)-3-[(Cyclopropylamino)methyl]-4-fluoropyrrolidin-1-yl}-6-fluoro-1-(2-fluoroethyl)-8-methoxy-4-oxo-1,4-dihydroquinoline-3-carboxylic acid monohydrochloride
CAS 登録番号　：*1433857-09-0*

2.　構造

構造式　：



分子式　：$C_{21}H_{24}F_3N_3O_4 \cdot HCl$
分子量　：475.89
立体化学　：ラスクフロキサシン塩酸塩は 2 箇所の不斉中心を有し、ピロリジン部位の 3 位及び 4 位が *S* 配置となる単一の光学活性化合物である。

3.　一般特性

性状　：白色～帯黄白色の結晶、結晶性の粉末又は塊である。
溶解性　：

各種溶媒に対する溶解度(25°C ± 2°C)

溶媒	溶解度(mg/mL)	溶媒	溶解度(mg/mL)
N,*N*-ジメチルホルムアミド	37.1	水	21.7
エタノール(99.5)	2.36	生理食塩液	1.00
1-オクタノール	0.0466	5%ブドウ糖溶液	19.7
メタノール	≥16.6	5% D-マンニトール溶液	19.8
アセトニトリル	0.361～0.828	0.1 mol/L 塩酸	2.08
		0.01 mol/L 塩酸	17.7

各種 pH の McIlvaine 緩衝液に対する溶解度(25℃ ± 2℃)

pH (McIlvaine の緩衝液)	溶解度(mg/mL)
3.0	8.58
4.0	1.37
5.0	0.686
6.0	0.680
7.0	0.532
8.0	0.650

分配係数　：1-オクタノール/pH 7.0 の McIlvaine 緩衝液(25℃ ± 2℃)の系における分配比は 6.40 であった。
融点　：明確な融点は認められない。
吸湿性　：吸湿性は認められない。
酸塩基解離定数 pKa：6.24、7.99

4. 安定性

ラスクフロキサシン塩酸塩の安定性試験の結果のまとめ

試験		保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験		25℃/60%RH	ポリエチレン袋 +アルミニウム袋 +ファイバードラム	36 箇月	安定
加速試験		40℃/75%RH	ポリエチレン袋 +アルミニウム袋 +ファイバードラム	6 箇月	安定
苛酷試験	温度	60℃	褐色ガラス瓶 (密栓)	3 箇月	安定
	湿度	30℃/75%RH	褐色ガラス瓶 (開栓)	3 箇月	安定
	光	オプション 1 (D65) 約 2000 lx　25℃	ガラス製シャーレ (開放)	120 万 lx·h	性状で変化(着色)を認めたが，その他の項目は評価基準に適合した.
			ガラス製シャーレ (アルミホイル遮光)	120 万 lx·h	安定

2.3.P　製剤*

1. 製剤の組成

販売名	ラスビック錠 75mg
成分・含量	1 錠中にラスクフロキサシンとして 75 mg 含有
添加剤	アルギン酸、クエン酸二水素ナトリウム、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 400、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

2. 安定性

ラスビック錠 75mgの安定性試験の結果のまとめ

試験		保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験		25°C/60%RH	PTP 包装[a] +紙箱	36 箇月	安定
加速試験		40°C/75%RH	PTP 包装[a] +紙箱	6 箇月	安定
苛酷試験	温度	50°C	褐色ガラス瓶 (密栓)	3 箇月	安定
	湿度	30°C/75%RH	無包装	3 箇月	安定
			PTP 包装[a]	3 箇月	安定
	光	オプション 1 (D65) 約 2000 lx　25°C	無包装	120 万 lx·h	安定
			PTP 包装[a]		

a：PTP 包装　(片面ポリプロピレンフィルム、片面アルミニウム箔)

*「2.3 品質に関する概括評価」を新薬承認情報提供時に本項と置き換えた。