

## レボフロキサシン錠

## Levofloxacin Tablets

本品は定量するとき、表示量の 95.0～105.0% に対応するレボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$  : 361.37)を含む。

**製法** 本品は「レボフロキサシン水和物」をとり、錠剤の製法により製する。

**確認試験** 本品を粉末とし、表示量に従いレボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$ )0.1g に対応する量を取り、薄めた 3mol/L 塩酸試液(1→100)を加えて 100mL とし、20 分間かき混ぜる。この液を孔径 0.45 $\mu$ m 以下のメンブランフィルターでろ過し、初めのろ液 10mL を除き、次のろ液 1mL を量り、薄めた 3mol/L 塩酸試液(1→100)を加えて 100mL とする。この液につき、紫外可視吸光度測定法 (2.24) により吸収スペクトルを測定するとき、波長 225～229nm 及び 292～296nm に吸収の極大を、波長 321～331nm に吸収の肩を示す。

**製剤均一性** (6.02) 次の方法により含量均一性試験を行うとき、適合する。

本品 1 個をとり、薄めた 3mol/L 塩酸試液(1→100)約 70mL を加え、錠剤が崩壊するまで超音波処理を行った後、薄めた 3mol/L 塩酸試液(1→100)を加えて正確に 100mL とし、20 分間かき混ぜる。この液  $V$  mL を正確に量り、1mL 中にレボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$ )約 50 $\mu$ g を含む液となるように薄めた 3mol/L 塩酸試液(1→100)を加えて正確に  $V'$  mL とし、孔径 0.45 $\mu$ m 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、次のろ液を試料溶液とする。以下定量法を準用する。

レボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$ )の量(mg) =  $M_S \times A_T / A_S \times V' / V \times 1 / 5$

$M_S$  : 脱水物に換算した定量用レボフロキサシン水和物の秤取量(mg)

**溶出性** (6.10)

(1) 100mg 錠 試験液に水 900mL を用い、パドル法により、毎分 50 回転で試験を行うとき、本品の 90 分間の溶出率は 80% 以上である。

本品 1 個をとり、試験を開始し、規定された時間に溶出液 20mL 以上をとり、孔径 0.45 $\mu$ m 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 5mL を正確に量り、水を加えて正確に 100mL とし、試料溶液とする。別に定量用レボフロキサシン水和物(別途「レボフロキサシン水和物」と同様の方法で水分 (2.48) を測定しておく)約 28mg を精密に量り、水に溶かし、正確に 100mL とする。この液 2mL を正確に量り、水を加えて正確に 100mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、紫外可視吸光度測定法 (2.24) により試験を行い、波長 289nm における吸光度  $A_T$  及び  $A_S$  を測定する。

レボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$ )の表示量に対する溶出率(%) =  $M_S \times A_T / A_S \times 18 / 5$

$M_S$  : 脱水物に換算した定量用レボフロキサシン水和物の秤取量(mg)

(2) 250mg 錠及び 500mg 錠 試験液に溶出試験第 2 液 900mL を用い、パドル法により、毎分 50 回転で試験を行うとき、本品の 30 分間の溶出率は 80% 以上である。

本品 1 個をとり、試験を開始し、規定された時間に溶出液 20mL 以上をとり、孔径 0.45 $\mu$ m 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  $V$  mL を正確に量り、表示量に従い 1mL 中にレボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$ )約 11.2 $\mu$ g 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。別に定量用レボフロキサシン水和物(別途「レボフロキサシン水和物」と同様の方法で水分 (2.48) を測定しておく)約 28mg を精密に量り、試験液に溶かし、正確に 50mL とする。この液 2mL を正確に量り、試験液を加えて正確に 100mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、紫外可視吸光度測定法 (2.24) により試験を行い、波長 287nm における吸光度  $A_T$  及び  $A_S$  を測定する。

レボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$ )の表示量に対する溶出率(%) =  $M_S \times A_T / A_S \times V' / V \times 1 / C \times 36$

$M_S$  : 脱水物に換算した定量用レボフロキサシン水和物の秤取量(mg)

$C$  : 1 錠中のレボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$ )の表示量(mg)

**定量法** 本品 20 個以上をとり、その質量を精密に量り、粉末とする。レボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$ )約 1g に対応する量を精密に量り、薄めた 3mol/L 塩酸試液(1→100)150mL を加え、5 分間超音波処理した後、薄めた 3mol/L 塩酸試液(1→100)を加えて正確に 200mL とし、10 分間かき混ぜる。この液 2mL を正確に量り、薄めた 3mol/L 塩酸試液

45 (1→100)を加えて正確に 200mLとし、孔径 0.45 $\mu$ m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  
 46 き、次のろ液を試料溶液とする。別に定量用レボフロキサシン水和物(別途「レボフロキサシン水和物」と同様の方法  
 47 で水分(2.48)を測定しておく)約 25mgを精密に量り、薄めた 3mol/L塩酸試液(1→100)に溶かし、正確に 50mLとす  
 48 る。この液 2mLを正確に量り、薄めた 3mol/L塩酸試液(1→100)を加えて正確に 20mLとし、標準溶液とする。試料  
 49 溶液及び標準溶液 10 $\mu$ L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  
 50 れの液のレボフロキサシンのピーク面積 $A_T$ 及び $A_S$ を測定する。

51 レボフロキサシン( $C_{18}H_{20}FN_3O_4$ )の量(mg)= $M_S \times A_T / A_S \times 40$

52  $M_S$  : 脱水物に換算した定量用レボフロキサシン水和物の秤取量(mg)

53 試験条件

54 検出器 : 紫外吸光光度計(測定波長 : 340 nm)

55 カラム : 内径 4.6mm, 長さ 15cm のステンレス管に 5 $\mu$ m の液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル化シ  
 56 リカゲルを充てんする。

57 カラム温度 : 45 $^{\circ}$ C付近の一定温度

58 移動相 : 硫酸銅(II)五水和物 1.00g, L-バリン 1.41g 及び酢酸アンモニウム 6.17g を水 800mL に溶かす。この  
 59 液にメタノール 200 mL を加える。

60 流量 : レボフロキサシンの保持時間が約 20 分になるように調整する。

61 システム適合性

62 システムの性能 : オフロキサシン 10mg を薄めた 3mol/L 塩酸試液(1→100)20mL に溶かす。この液 1mL を量り、  
 63 薄めた 3mol/L 塩酸試液(1→100)を加えて 20mL とする。この液 10 $\mu$ L につき、上記の条件で操作するとき、  
 64 レボフロキサシン、光学異性体の順に溶出し、その分離度は 3 以上である。

65 システムの再現性 : 標準溶液 10 $\mu$ L につき、上記の条件で試験を 6 回繰り返すとき、レボフロキサシンのピーク  
 66 面積の相対標準偏差は 1.0%以下である。

67 貯法 容器 気密容器。  
 68 -----

69 9.41 試薬・試液の項に次を追加する。

70 レボフロキサシン水和物, 定量用  $C_{18}H_{20}FN_3O_4 \cdot \frac{1}{2}H_2O$  [医薬品各条, 「レボフロキサシン水和物」]

71

72