

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2023.03.23 初版

|                             |   |                              |
|-----------------------------|---|------------------------------|
| 有効成分                        | ブホルミン塩酸塩  |                              |
| 品目名（製造販売業者）<br>【後発医薬品】      | 1   | ブホルミン塩酸塩腸溶錠 50mg 「KO」<br>寿製薬 |
| 品目名（製造販売業者）<br>【先発医薬品】      | ①   | なし                           |
| 効能・効果                       | <a href="https://www.bbdb.jp">https://www.bbdb.jp</a>                         |                              |
| 用法・用量                       | <a href="https://www.bbdb.jp">https://www.bbdb.jp</a>                         |                              |
| 添加物                         | <a href="https://www.bbdb.jp">https://www.bbdb.jp</a>                         |                              |
| 解離定数 <sup>1)</sup><br>(30℃) | pKa <sub>1</sub> : 2.92 (ビグアニド基、滴定法)<br>pKa <sub>2</sub> : 11.28 (ビグアニド基、滴定法) |                              |
| 溶解度 <sup>1)</sup><br>(37℃)  | pH1.2 : 382mg/mL<br>pH4.0 : 405mg/mL<br>pH6.8 : 366mg/mL<br>水 : 395mg/mL      |                              |
| 原薬の安定性 <sup>1)</sup>        | 水   | なし                           |
|                             | 液性(pH)  | なし                           |
|                             | 光   | なし                           |
|                             | その他   | なし                           |
| 膜透過性                        | なし  |                              |
| BCS・Biowaiver option        | なし  |                              |
| 薬効分類                        | 396 糖尿病用剤   |                              |
| 規格単位                        | 50mg 1錠   |                              |

【記載データ一覧】

|   | 品目名                   | 製造販売業者 | BE | 品質<br>再評価 | 溶出 | 検査 |
|---|-----------------------|--------|----|-----------|----|----|
| 1 | ブホルミン塩酸塩腸溶錠 50mg 「KO」 | 寿製薬    |    | ○*        |    |    |

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 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<sup>2)</sup>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。【4 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。【5 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。【6 ページ】

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1

なし

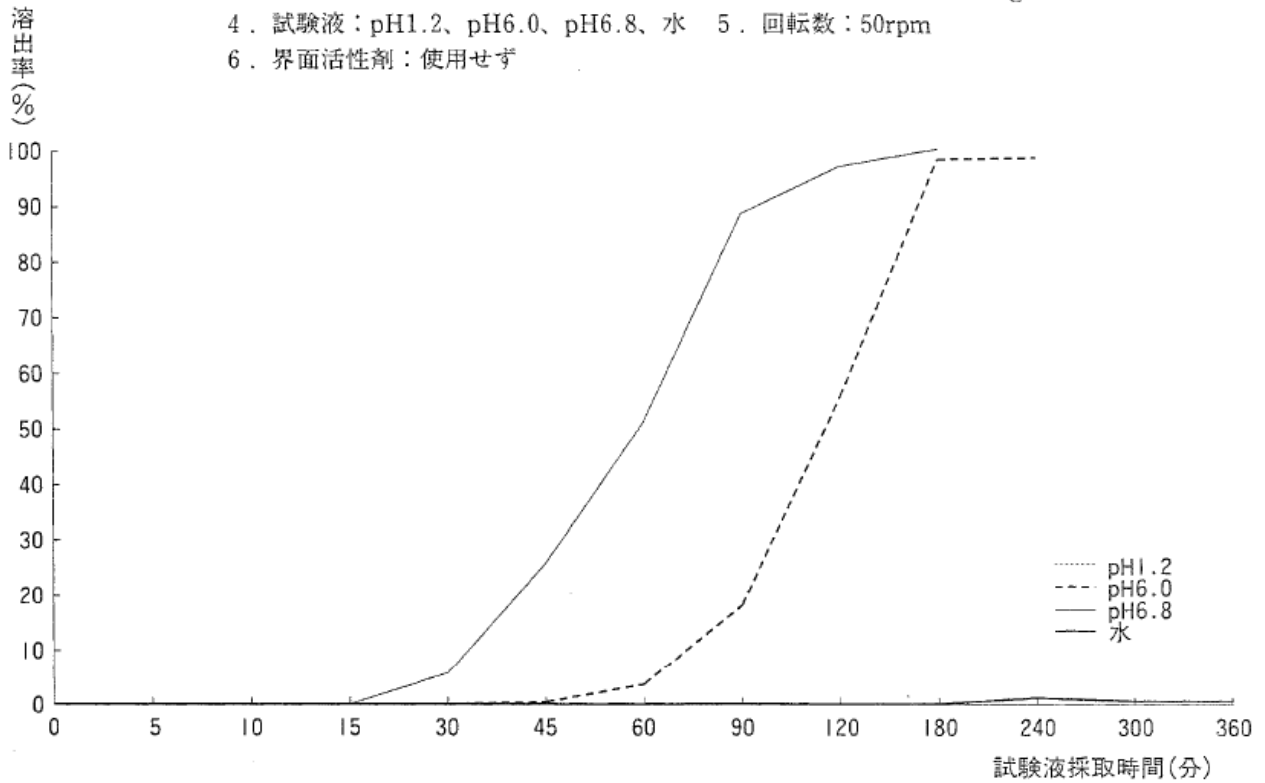
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】<sup>1)</sup>

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

塩酸ブホルミン腸溶錠 50mg

1. 有効成分名：塩酸ブホルミン
2. 剤形：腸溶錠
3. 含量：50mg
4. 試験液：pH1.2、pH6.0、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

**ブホルミン塩酸塩腸溶錠**  
**Buformin Hydrochloride Delayed-release Tablets**

**溶出性** 〈6.10〉 試験液に溶出試験第1液及び溶出試験第2液900mLずつを用い、パドル法により、毎分50回転で試験を行うとき、試験液に溶出試験第1液を用いた場合の本品の120分間の溶出率は5%以下であり、試験液に溶出試験第2液を用いた場合の本品の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0.5 $\mu$ 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4mLを正確に量り、1mL中にブホルミン塩酸塩 ( $C_6H_{15}N_5 \cdot HCl$ ) 約56 $\mu$ 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。別に定量用ブホルミン塩酸塩を105°Cで3時間乾燥し、その約28mgを精密に量り、試験液に溶かし、正確に100mLとする。この液4mLを正確に量り、試験液を加えて正確に20mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液20 $\mu$ 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、それぞれの液のブホルミンのピーク面積 $A_1$ 及び $A_2$ を測定する。

ブホルミン塩酸塩 ( $C_6H_{15}N_5 \cdot HCl$ ) の表示量に対する溶出率 (%)

$$= M_s \times A_1 / A_2 \times V' / V \times 1 / C \times 180$$

$M_s$  : 定量用ブホルミン塩酸塩の秤取量 (mg)

$C$  : 1錠中のブホルミン塩酸塩 ( $C_6H_{15}N_5 \cdot HCl$ ) の表示量 (mg)

**試験条件**

検出器 : 紫外吸光光度計 (測定波長 : 230nm)

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リカゲルを充填する。

カラム温度 : 35°C付近の一定温度

移動相 : 過塩素酸ナトリウムの薄めたリン酸 (1→1000) 溶液 (7→500) / アセトニトリル混液 (7 : 1)

流量 : ブホルミンの保持時間が約6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20 $\mu$ Lにつき、上記の条件で操作するとき、ブホルミン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20 $\mu$ Lにつき、上記の条件で試験を6回繰り返すとき、ブホルミンのピーク面積の相対標準偏差は2.0%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 14 年 3 月版、厚生労働省医薬局審査管理課）
- 2) 医療用医薬品再評価結果 平成 13 年度（その 7）について（平成 14 年 3 月 6 日付け医薬発第 0306001 号、厚生労働省医薬局長）
- 3) 第十八改正日本薬局方（令和 3 年 6 月 7 日厚生労働省告示第 220 号）