

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2021. 12. 03 初版

有効成分	フレカイニド酢酸塩																								
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	フレカイニド酢酸塩錠 50mg 「KO」	寿製薬																						
	2	フレカイニド酢酸塩錠 50mg 「ファイザー」	ファイザー																						
	3	フレカイニド酢酸塩錠 50mg 「TE」	トーアエイヨー																						
	4	フレカイニド酢酸塩錠 100mg 「KO」	寿製薬																						
	5	フレカイニド酢酸塩錠 100mg 「ファイザー」	ファイザー																						
	6	フレカイニド酢酸塩錠 100mg 「TE」	トーアエイヨー																						
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	タンボコール錠 50mg	エーザイ																						
	②	タンボコール錠 100mg	エーザイ																						
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⁾ (室温)	pKa : 9.36 (ピペリジン環、吸光度法)																								
溶解度 ¹⁾ (37°C)	pH1.2 : 2.1mg/mL pH4.0 : 72.5mg/mL pH6.8 : 37.2mg/mL 水 : 58.2mg/mL																								
原薬の安定性 ²⁾	水	フレカイニド酢酸塩を水に溶解し、50°Cで14日間保存したときは安定であった。																							
	液性(pH)	フレカイニド酢酸塩をアルカリ溶液(0.1mol/L水酸化ナトリウム)に溶解し、50°Cで保存したとき、2種の分解物(イミダゾ体及びTFBA)を生成するが、酸性溶液(0.1mol/L塩酸)に溶解し、50°Cで14日間保存したときは安定であった。 以上より、フレカイニド酢酸塩は酸性及び中性の水溶液中では安定である。																							
	光	<table border="1"> <thead> <tr> <th>試験方法</th> <th>保存条件</th> <th>包装形態</th> <th>保存期間</th> <th>測定項目</th> <th>結果</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>苛酷試験 光</td> <td>1000lx</td> <td>石英管密栓</td> <td>3カ月</td> <td>性状 確認試験 乾燥減量 含</td> <td>いずれの測定項目も変化を認めなかった</td> </tr> </tbody> </table> <p>以上より、フレカイニド酢酸塩は光に対し安定である。</p>		試験方法	保存条件	包装形態	保存期間	測定項目	結果	苛酷試験 光	1000lx	石英管密栓	3カ月	性状 確認試験 乾燥減量 含	いずれの測定項目も変化を認めなかった										
試験方法	保存条件	包装形態	保存期間	測定項目	結果																				
苛酷試験 光	1000lx	石英管密栓	3カ月	性状 確認試験 乾燥減量 含	いずれの測定項目も変化を認めなかった																				
その他	<table border="1"> <thead> <tr> <th>試験方法</th> <th>保存条件</th> <th>包装形態</th> <th>保存期間</th> <th>測定項目</th> <th>結果</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td rowspan="2">苛酷試験 湿度</td> <td>40°C 75%RH</td> <td>ガラス瓶開放</td> <td>3カ月</td> <td rowspan="2">性状 確認試験 乾燥減量 含</td> <td>いずれの測定項目も変化を認めなかった</td> </tr> <tr> <td>温度</td> <td>45°C</td> <td>ガラス瓶密栓</td> <td>3カ月</td> <td>いずれの測定項目も変化を認めなかった</td> </tr> <tr> <td>長期保存試験</td> <td>室温</td> <td>ガラス瓶密栓</td> <td>36カ月</td> <td></td> <td>いずれの測定項目も変化を認めなかった</td> </tr> </tbody> </table> <p>以上より、フレカイニド酢酸塩は温度、湿度に対し安定であり、気密容器に保存すれば室温で3年間は安定である。</p>		試験方法	保存条件	包装形態	保存期間	測定項目	結果	苛酷試験 湿度	40°C 75%RH	ガラス瓶開放	3カ月	性状 確認試験 乾燥減量 含	いずれの測定項目も変化を認めなかった	温度	45°C	ガラス瓶密栓	3カ月	いずれの測定項目も変化を認めなかった	長期保存試験	室温	ガラス瓶密栓	36カ月		いずれの測定項目も変化を認めなかった
試験方法	保存条件	包装形態	保存期間	測定項目	結果																				
苛酷試験 湿度	40°C 75%RH	ガラス瓶開放	3カ月	性状 確認試験 乾燥減量 含	いずれの測定項目も変化を認めなかった																				
	温度	45°C	ガラス瓶密栓		3カ月	いずれの測定項目も変化を認めなかった																			
長期保存試験	室温	ガラス瓶密栓	36カ月		いずれの測定項目も変化を認めなかった																				
膜透過性	なし																								
BCS・Biowaiver option	なし																								

薬効分類	212 不整脈用剤
規格単位	50mg 1錠 100mg 1錠

【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	フレカイニド酢酸塩錠 50mg 「KO」	寿製薬	○			
2	フレカイニド酢酸塩錠 50mg 「ファイザー」	ファイザー	○			
3	フレカイニド酢酸塩錠 50mg 「TE」	トーアエイヨー	○			
4	フレカイニド酢酸塩錠 100mg 「KO」	寿製薬	○			
5	フレカイニド酢酸塩錠 100mg 「ファイザー」	ファイザー	○			
6	フレカイニド酢酸塩錠 100mg 「TE」	トーアエイヨー	○			

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。【4~5 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³⁾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。【6 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。【7 ページ】

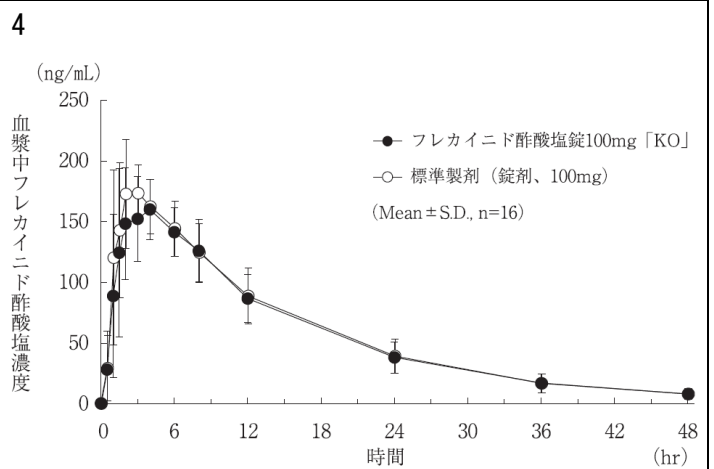
注) 「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【8 ページ】

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

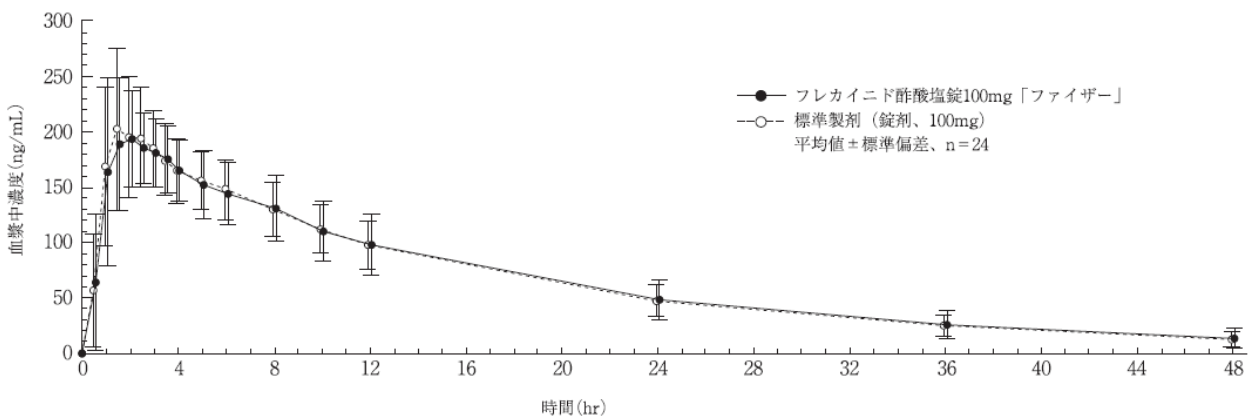
1
フレカイニド酢酸塩錠 50mg 「K0」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成24年2月29日付薬食審査発第0229号第10号）」に基づき、フレカイニド酢酸塩錠 100mg 「K0」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等で、生物学的に同等とみなされた。

2
フレカイニド酢酸塩錠 50mg 「ファイザー」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号）」に基づき、フレカイニド酢酸塩錠 100mg 「ファイザー」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等で、生物学的に同等とみなされた。

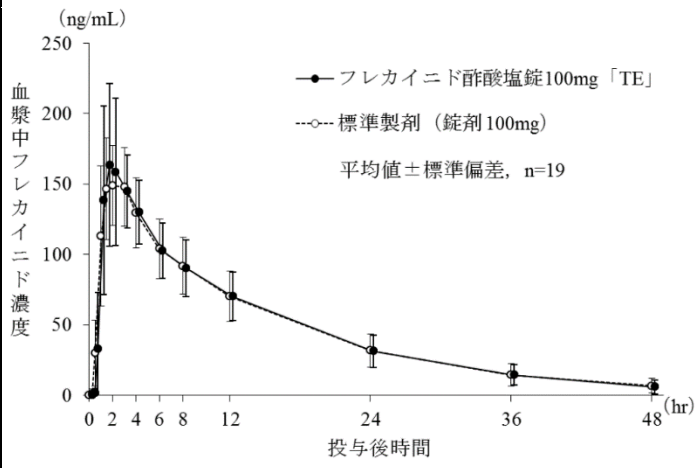
3
フレカイニド酢酸塩錠 50mg 「TE」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号）」に基づき、フレカイニド酢酸塩錠 100mg 「TE」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等で、生物学的に同等とみなされた。



5
血漿中フレカイニドの濃度推移

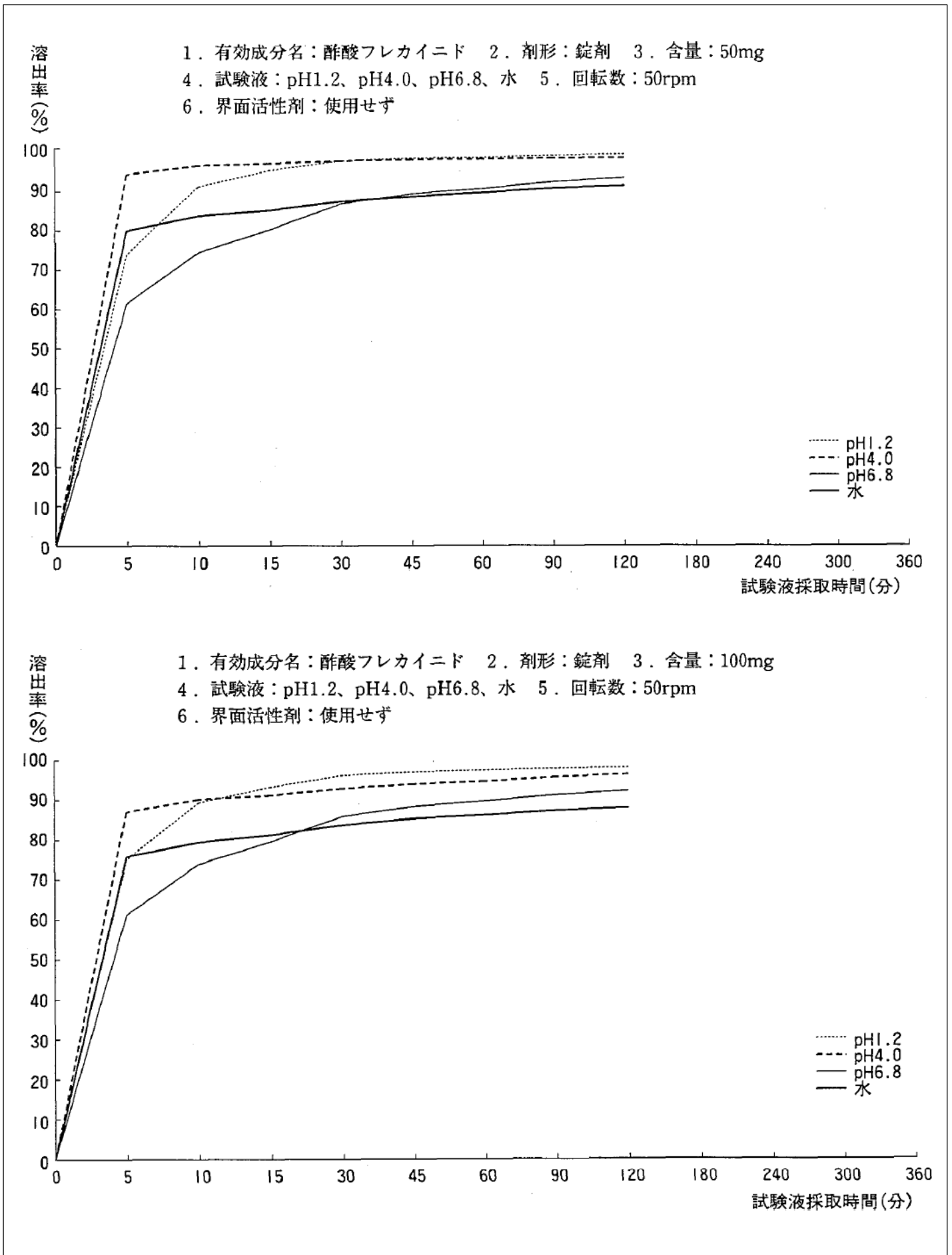


6



【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

フレカイニド酢酸塩錠
Flecainide Acetate Tablets

溶出性 〈6.10〉 試験液に水 900 mL 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 70%以上である。

本品 1 個をとり、試験を開始し、規定された時間に溶出液 20 mL 以上をとり、孔径 0.5 μ m 以下のメンブランフィルターでろ過する。初めのろ液 10 mL を除き、次のろ液 V mL を正確に量り、1 mL 中にフレカイニド酢酸塩 ($C_{17}H_{20}F_6N_2O_3 \cdot C_2H_4O_2$) 約 56 μ g を含む液となるように水を加えて正確に V' mL とし、試料溶液とする。別に定量用フレカイニド酢酸塩を 60°C で 2 時間減圧 (0.67 kPa 以下) 乾燥し、その約 28 mg を精密に量り、水に溶かし、正確に 50 mL とする。この液 2 mL を正確に量り、水を加えて正確に 20 mL 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 296 nm における吸光度 A_T 及び A_S を測定する。

フレカイニド酢酸塩 ($C_{17}H_{20}F_6N_2O_3 \cdot C_2H_4O_2$) の表示量に対する溶出率 (%)

$$= M_s \times A_T / A_S \times V' / V \times 1 / C \times 180$$

M_s : 定量用フレカイニド酢酸塩の秤取量 (mg)

C : 1 錠中のフレカイニド酢酸塩 ($C_{17}H_{20}F_6N_2O_3 \cdot C_2H_4O_2$) の表示量 (mg)

【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、厚生労働省医薬局審査管理課）
- 2) タンボコール錠 50mg／100mg／細粒 10%（製造販売元：エーザイ株式会社）医薬品インタビューフォーム（2015 年 6 月改訂、第 12 版）
- 3) 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 日付け薬食発第 715 号、厚生労働省医薬局長）
- 4) 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）