

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2018. 7. 13 初版

有効成分	クレマスチンフマル酸塩		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	マルスチン錠 1mg	東和薬品
	2	テルギンG錠 1mg	高田製薬
	3	クレマスチン錠 1mg 「YD」	陽進堂
	4	クレマスチン錠 1mg 「日医工」	日医工
	5	クレマスチン錠 1mg 「イセイ」	コーアイセイ
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	タベジール錠 1mg	日新製薬（山形）
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⁾ (20°C)	pKa : 9.45±0.1 (滴定法)		
溶解度 ¹⁾ (37°C)	pH1.2 : -* mg/mL (*pH1.2 : 分解のため溶解度を求めず) pH4.0 : 2.4mg/mL pH6.8 : 5.5mg/mL 水 : 2.0mg/mL		
原薬の安定 性等 ¹⁾	水	なし	
	液性(pH)	pH1.2、10分で約50%分解する。	
	光	なし	
	その他	本品はガラス器具等へ吸着し、pH1.2、6.8でその傾向が強い。	
膜透過性	なし		
BCS・Biowaiver option	なし		
薬効分類	441 抗ヒスタミン剤		
規格単位	1mg 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	マルスチン錠 1mg	東和薬品	○+	○		○
2	テルギンG錠 1mg	高田製薬	○+	○*		○
3	クレマスチン錠 1mg 「YD」	陽進堂	○+	○*		○*
4	クレマスチン錠 1mg 「日医工」	日医工		○*		○*
5	クレマスチン錠 1mg 「イセイ」	コーアイセイ	○+	○*		○*

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。○印の右に+印がついているものは動物試験のデータ。【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。【4 ページ】

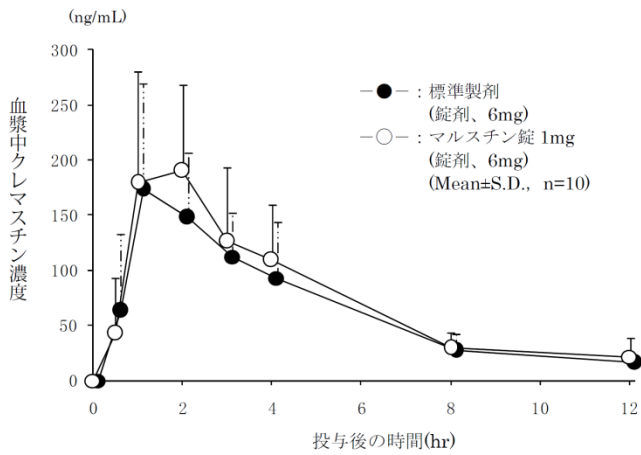
注)「溶出」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である（上記表中の番号は、本情報集に掲載された溶出試験結果中の番号と対応している。）。全品目で空欄となっている場合は、溶出試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【5 ページ】

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】

*：旧販売名で記載

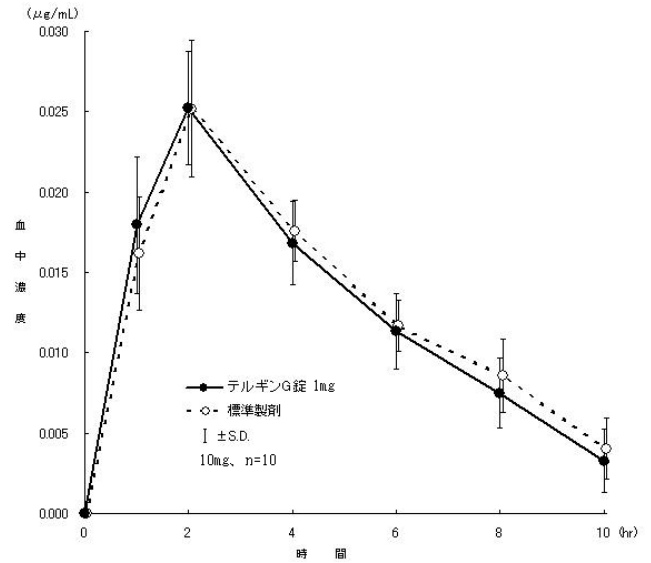
【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1 <参考> 雌性ビーグル犬



(インタビューフォームより)

2 <参考> 雄性イヌ



(社内資料より)

3 <参考> 雄性ビーグル犬

クレマスチン錠 1mg「YD」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 100 錠 (クレマスチンとして 100mg) 健康なビーグル犬 (雄性、n=10) に単回経口投与し、血中クレマスチン濃度について比較検討した結果、両製剤には統計学的に有意差のないことが認められた。

(インタビューフォームより)

4
なし

5 <参考>

クレマスチン錠 1mg「イセイ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 10 錠 (クレマスチンとして 10mg) を日本白色種雄性家兎 (n=10) に絶食後単回投与して、血中クレマスチン濃度を測定し、統計解析を行った結果、両製剤の血中濃度推移に有意差は認められなかった。

(社内資料より)

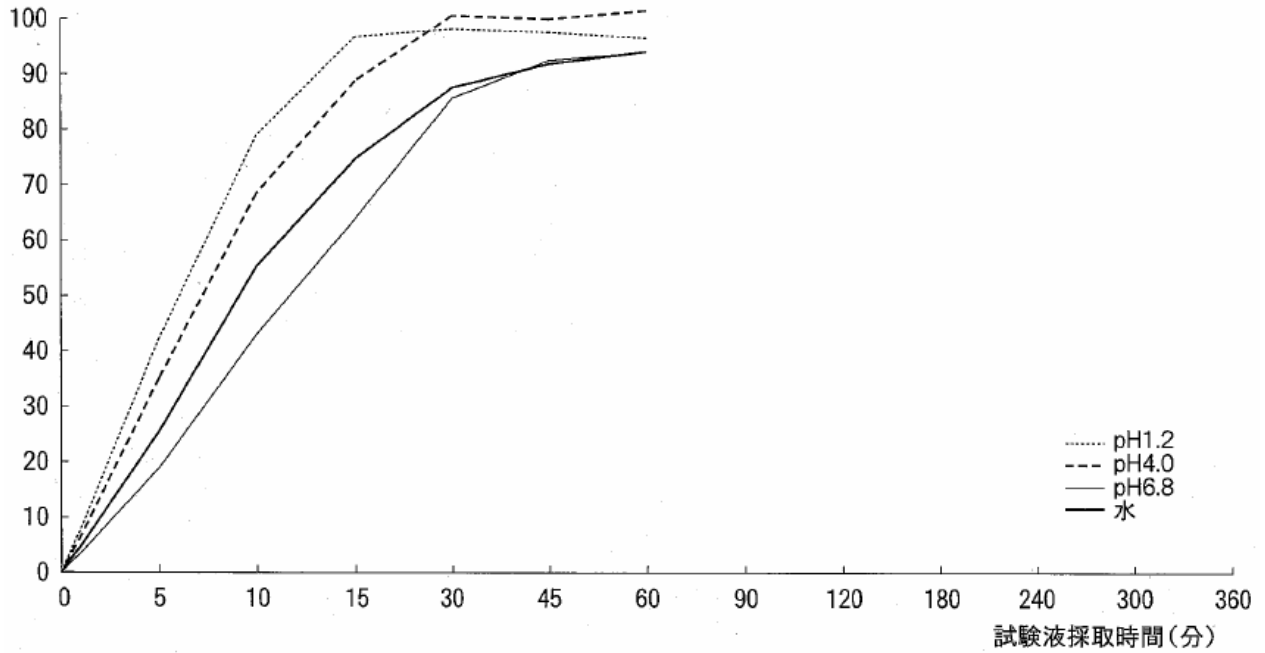
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

フマル酸クレマスチン錠 1 mg

1. 有効成分名：フマル酸クレマスチン 2. 剤形：錠剤 3. 含量：1 mg
(クレマスチンフマル酸塩)
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】³⁾

平成 22 年度（溶出試験） 適

クレマスチン fumarate 錠
Clemastine Fumarate Tablets

溶出性 〈6.10〉 本品 1 個をとり、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。溶出試験を開始し、規定時間後、溶出液 20mL 以上をとり、孔径 0.5 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、表示量に従い 1mL 中にクレマスチン (C₂₁H₂₆ClNO) 約 0.56 μg を含む液となるように移動相を加えて正確に V' mL とし、試料溶液とする。別に、クレマスチン fumarate 標準品を 105°C で 4 時間乾燥し、その約 30mg を精密に量り、水に溶かし、正確に 100mL とする。この液 5mL を正確に量り、水を加えて正確に 100mL とする。更にこの液 10mL を正確に量り、水を加えて正確に 100mL とする。この液 5mL を正確に量り、移動相を加えて正確に 10mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 50 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、それぞれの液のクレマスチンのピーク面積 A_T 及び A_S を測定する。

本品が溶出規格を満たすときは適合とする。

クレマスチン (C₂₁H₂₆ClNO) の表示量に対する溶出率 (%)

$$= W_s \times (A_T / A_S) \times (V' / V) \times (1 / C) \times (9 / 4) \times 0.748$$

W_s: クレマスチン fumarate 標準品の秤取量 (mg)

C: 1 錠中のクレマスチン (C₂₁H₂₆ClNO) の表示量 (mg)

試験条件

検出器: 紫外吸光光度計 (測定波長: 220nm)

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てんする。

カラム温度: 40°C 付近の一定温度

移動相: リン酸二水素カリウム 9.0g 及び 1-オクタンスルホン酸ナトリウム 2.0g を水 1100mL に溶かした液に、アセトニトリル 900mL を加えた後、リン酸で pH4.0 に調整する。

流量: クレマスチンの保持時間が約 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 50 μL につき、上記の条件で操作するとき、クレマスチ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 50 μL につき、上記の条件で試験を 6 回繰り返すとき、クレマスチンのピーク面積の相対標準偏差は 2.0% 以下である。

溶出規格

表示量*	規定時間	溶出率
1mg	30 分	80% 以上

*クレマスチンとして

クレマスチン fumarate 標準品 クレマスチン fumarate (日局)。ただし、乾燥したものを定量するとき、クレマスチン fumarate (C₂₁H₂₆ClNO · C₄H₄O₄) 99.0% 以上を含む。

【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 22 年 2 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 19 年度（その 4）について（平成 20 年 1 月 7 日付け薬食発第 0107001 号、厚生労働省医薬食品局長）
- 3) 平成 22 年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成 23 年 7 月、厚生労働省医薬食品局監視指導・麻薬対策課）
- 4) 日本薬局方外医薬品規格第三部の一部改正について（平成 20 年 1 月 7 日付け薬食発第 0107005 号、厚生労働省医薬食品局長通知）