

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2020. 12. 24 初版

有効成分	セファレキシン	
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	セファレキシン顆粒500mg「JG」 長生堂製薬
	2	セファレキシン複合顆粒500mg「トーワ」 東和薬品
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	レーケフレックス小児用顆粒 共和薬品工業
	②	レーケフレックス顆粒 共和薬品工業
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⁾	pKa ₁ : 3.65（カルボキシル基） pKa ₂ : 7.14（アミノ基）	
溶解度 ¹⁾ (37℃)	pH1.2 : 40mg/mL pH4.0 : 13mg/mL pH6.8 : 15mg/mL 水 : 13mg/mL	
原薬の安定性 ¹⁾	水	加熱により分解する。
	液性(pH)	pH 1.0 : 6 日間は安定である。 pH 5.6 : 24 時間は安定である。 pH 6.86 : 6 時間は安定である。 pH10.0 : 6 時間は安定である。
	光	なし
	その他	なし
膜透過性	なし	
BCS・Biowaiver option	なし	
薬効分類	613 主としてグラム陽性・陰性菌に作用するもの	
規格単位	500mg 1g	

【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	セファレキシン顆粒500mg「JG」	長生堂製薬	○	○*		○*
2	セファレキシン複合顆粒500mg「トーフ」	東和薬品	○†	○*		○*

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】

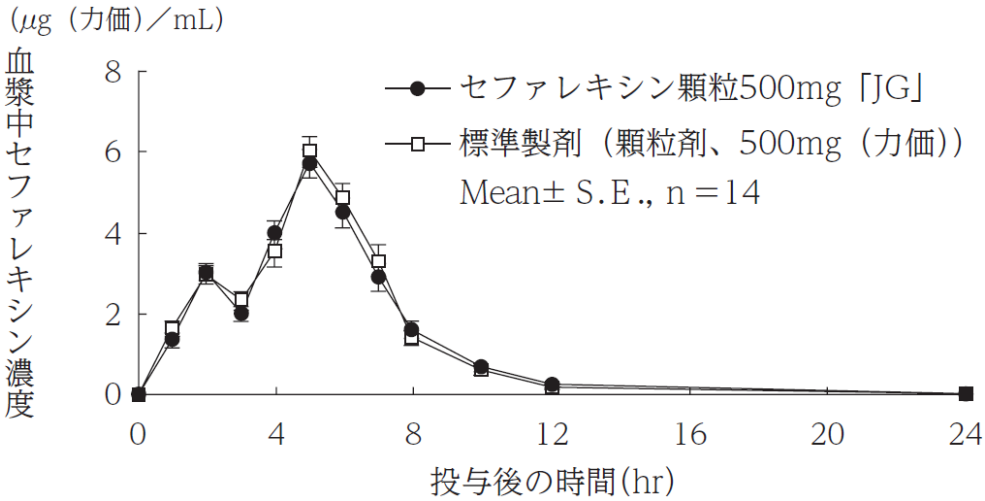
注)「溶出」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である(上記表中の番号は、本情報集に掲載された溶出試験結果中の番号と対応している)。全品目で空欄となっている場合は、溶出試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【5ページ】

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

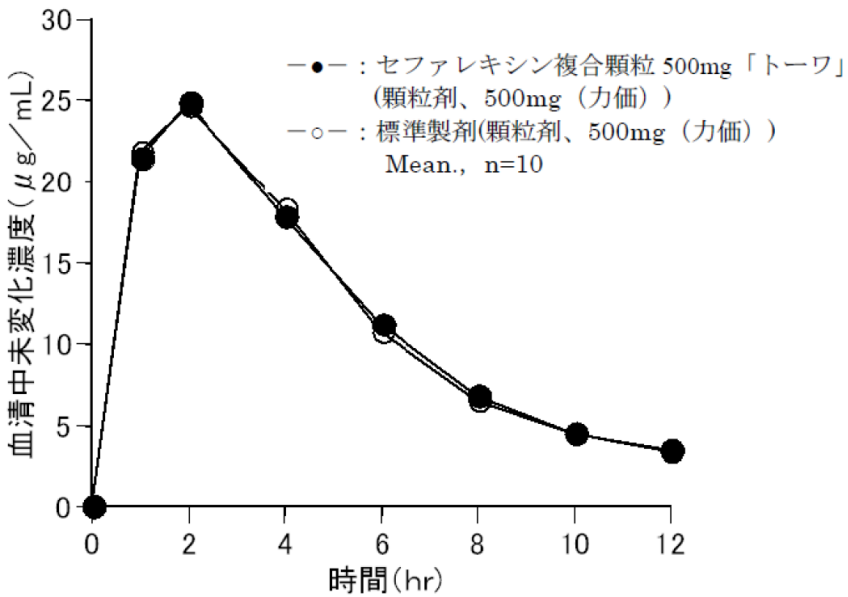
【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1



2 <参考>

動物実験 (雄性ビーグル犬) における成績



(インタビューフォームより)

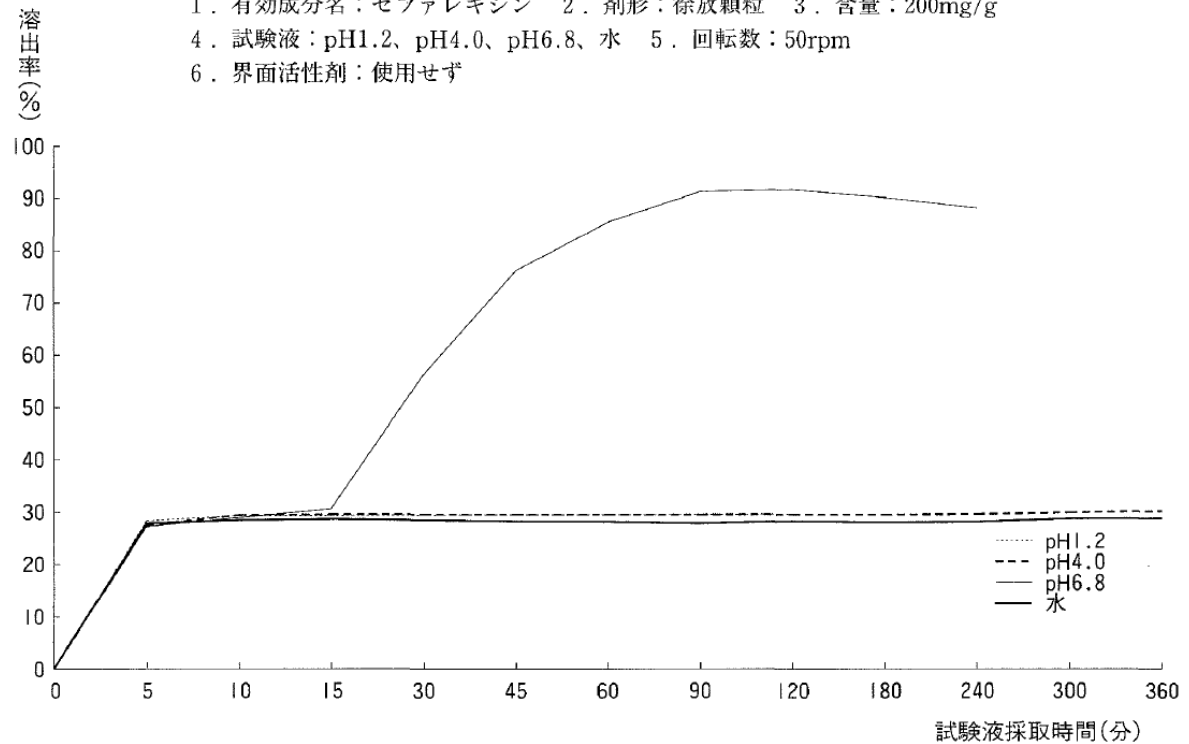
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

セファレキシン徐放顆粒 20%

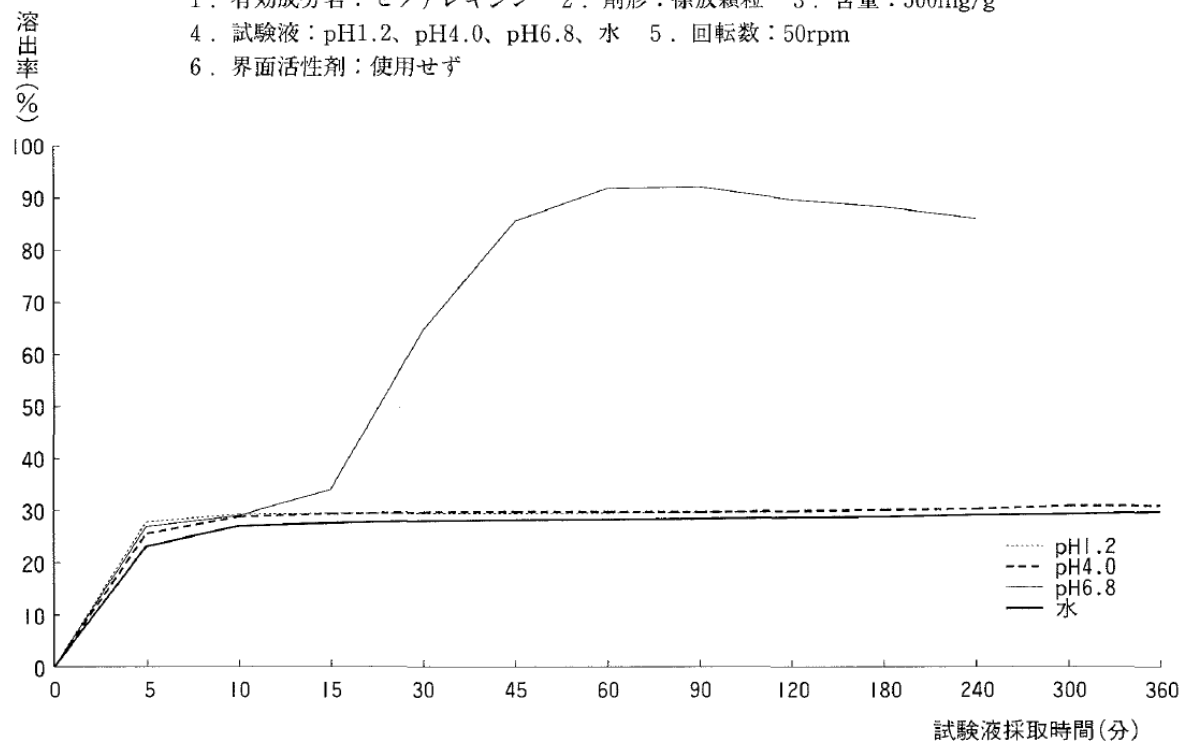
- 1. 有効成分名：セファレキシン
- 2. 剤形：徐放顆粒
- 3. 含量：200mg/g
- 4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
- 5. 回転数：50rpm
- 6. 界面活性剤：使用せず



溶出曲線測定例

セファレキシン徐放顆粒 50%

- 1. 有効成分名：セファレキシン
- 2. 剤形：徐放顆粒
- 3. 含量：500mg/g
- 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 21 年度（溶出試験） 適

セファレキシン複合顆粒
Gefalexin Combination Granules

溶出性〈6.10〉 試験液に溶出試験第1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 25～35% である。

本品 1 包をとり、内容物の全量を取り出し、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 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、表示された胃溶性顆粒の力価に従い 1mL 中に「セファレキシン」約 22 μg (力価) 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。別にセファレキシン標準品約 22mg (力価) に対応する量を精密に量り、試験液に溶かし、正確に 50mL とする。この液 5mL 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 262nm における吸光度 A_1 及び A_2 を測定する。

セファレキシン ($C_{16}H_{17}N_3O_4S$) の表示力価に対する溶出率 (%)

$$= M_s \times A_1 / A_2 \times V' / V \times 1 / C \times 90$$

M_s : セファレキシン標準品の秤取量 [mg (力価)]

C : 1 包中の「セファレキシン」の表示全力価 [mg (力価)]

また、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、200mg (力価) 製剤の 60 分間の溶出率は 80% 以上であり、500mg (力価) 製剤の 45 分間の溶出率は 75% 以上である。

本品 1 包をとり、内容物の全量を取り出し、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 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、表示全力価に従い 1mL 中に「セファレキシン」約 22 μg (力価) 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。別にセファレキシン標準品約 22mg (力価) に対応する量を精密に量り、試験液に溶かし、正確に 50mL とする。この液 5mL 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 262nm における吸光度 A_1 及び A_2 を測定する。

セファレキシン ($C_{16}H_{17}N_3O_4S$) の表示力価に対する溶出率 (%)

$$= M_s \times A_1 / A_2 \times V' / V \times 1 / C \times 90$$

M_s : セファレキシン標準品の秤取量 [mg (力価)]

C : 1 包中の「セファレキシン」の表示全力価 [mg (力価)]

【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 16 年 6 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 16 年度（その 1）について（平成 16 年 5 月 17 日付け薬食発第 0517002 号、厚生労働省医薬食品局長）
- 3) 平成 21 年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成 22 年 8 月、厚生労働省医薬食品局監視指導・麻薬対策課）
- 4) 第十七改正日本薬局方（平成 28 年 3 月 7 日厚生労働省告示第 64 号）