

レボフロキサシン点眼液0.5%「科研」 安定性試験

発 売 元: 科研製薬株式会社
製造販売元: ダイト株式会社

レボフロキサシン点眼液 0.5%「科研」の安定性に関する資料

【はじめに】

レボフロキサシン点眼液 0.5%「科研」の各種安定性試験（長期保存試験、加速試験、光安定性試験）を行った。

【検体】

レボフロキサシン点眼液 0.5%「科研」（製造販売元：ダイト株式会社）
ロット番号：LV-01、LV-02、LV-03（光安定性試験はLV-01のみ）

【包装形態】

長期保存試験：最終包装形態（上記3ロットをポリエチレン容器に充てんし、紙箱で包装したもの）
加速試験：一次包装（上記3ロットをポリエチレン容器に充てんしたもの）
光安定性試験：一次包装（上記1ロットをポリエチレン容器に充てんしたもの）
最終包装形態（上記1ロットをポリエチレン容器に充てんし、紙箱で包装したもの）

【試験条件及び試験項目】

試験の種類	試験条件		試験項目
	保存条件	保存期間	
長期保存試験	25±2℃ 60±5%RH	3年	・ 性状 ・ 確認試験 (1) 注2) ・ 確認試験 (2) 注2) ・ 浸透圧比 注2) ・ pH ・ 不溶性異物試験 ・ 不溶性微粒子試験 ・ 無菌試験 注2) ・ 定量
加速試験	40±1℃ 75±5%RH	6ヵ月	
光安定性試験	蛍光灯下 (約 1000lx・hr)	総照度 120万 lx・hr 注1) (約 50日)	

注1) 一次包装については、総照度 30万 lx・hr 時点で終了

注2) 長期保存試験、加速試験のみ

【試験期間】

2008年11月～2011年11月（長期保存試験）
2008年11月～2009年6月（加速試験）
2009年2月～2009年5月（光安定性試験）

【試験成績】

長期保存試験成績を表1、加速試験成績を表2、光安定性試験成績を表3に示した。

【結論】

長期保存試験の結果、全てのロットにおいて、いずれの試験項目も承認規格を満たすものであった。従って、本剤は室温で36ヵ月は安定な製剤であることが確認された。
また、加速試験の結果、全てのロットにおいて、いずれの試験項目も承認規格を満たすものであった。
従って、本剤は通常遭遇する環境下では、使用期限の3年間は安定な製剤であることが確認された。
また、光安定性試験の結果、一次包装について、総照度 30万 lx・hr 照射後、性状の変化及び含量の低下を認めた。最終包装形態については、いずれも開始時からの変化は認められず、規格に適合するものであった。従って、本剤は光を避けて保存することが望ましいと考えられるため、貯法については「遮光保存」とした。

表 1：レボフロキシ点眼液 0.5%「科研」の長期保存試験成績（保存条件：25±2℃、60±5%RH）

時期		開始時			3ヵ月後			6ヵ月後			9ヵ月後			12ヵ月後		
試験項目	ロット番号	LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03
	規格															
性状	微黄色～淡黄色澄明の液	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験 (1)	波長225～229nm及び292～296nmに吸収の極大を示す	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
確認試験 (2)	内標準物質のピークに対するレボフロキサシンのピークの相対保持時間を比較するとき、それらは等しい。	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
浸透圧比	約1.0～1.1（生理食塩液に対する比）	1.03	1.03	1.04	—	—	—	1.05	1.05	1.05	—	—	—	1.04	1.04	1.04
pH	6.2～6.8	6.47	6.47	6.47	—	—	—	6.47	6.46	6.46	—	—	—	6.54	6.52	6.53
不溶性異物試験	不溶性異物を認めない	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子試験	平均微粒子数が1mL当たり300μm以上のものは1個以下である。	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
無菌試験	菌の発育を認めない	適合	適合	適合	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
定量	95.0～107.0%	102.3%	101.6%	102.2%	—	—	—	101.4%	101.5%	101.8%	—	—	—	102.3%	102.4%	102.4%

時期		18ヵ月後			24ヵ月後			30ヵ月後			36ヵ月後		
試験項目	ロット番号	LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03
	規格												
性状	微黄色～淡黄色澄明の液	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験 (1)	波長225～229nm及び292～296nmに吸収の極大を示す	—	—	—	—	—	—	—	—	—	適合	適合	適合
確認試験 (2)	内標準物質のピークに対するレボフロキサシンのピークの相対保持時間を比較するとき、それらは等しい。	—	—	—	—	—	—	—	—	—	適合	適合	適合
浸透圧比	約1.0～1.1（生理食塩液に対する比）	—	—	—	1.05	1.06	1.06	—	—	—	1.06	1.07	1.07
pH	6.2～6.8	—	—	—	6.48	6.45	6.45	—	—	—	6.44	6.42	6.43
不溶性異物試験	不溶性異物を認めない	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子試験	平均微粒子数が1mL当たり300μm以上のものは1個以下である。	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
無菌試験	菌の発育を認めない	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量	95.0～107.0%	—	—	—	103.2%	103.4%	103.6%	—	—	—	104.3%	103.5%	103.5%

表 2：レボフロキサシン点眼液 0.5%「科研」の加速試験成績（保存条件：40±1°C、75±5%RH）

試験項目	時期 ロット番号 規格	開始時			1ヵ月後			3ヵ月後			6ヵ月後		
		LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03	LV-01	LV-02	LV-03
性状	微黄色～淡黄色澄明の液	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験（1）	波長225～229nm及び292～296nmに吸収の極大を示す	適合	適合	適合	—	—	—	—	—	—	適合	適合	適合
確認試験（2）	内標準物質のピークに対するレボフロキサシンのピークの相対保持時間を比較するとき、それらは等しい。	適合	適合	適合	—	—	—	—	—	—	適合	適合	適合
浸透圧比	約1.0～1.1（生理食塩液に対する比）	1.03	1.03	1.04	1.04	1.05	1.07	1.06	1.04	1.05	1.05	1.06	1.06
pH	6.2～6.8	6.47	6.47	6.47	6.52	6.53	6.51	6.50	6.48	6.50	6.46	6.46	6.46
不溶性異物試験	不溶性異物を認めない	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子試験	平均微粒子数が1mL当たり300μm以上のものは1個以下である。	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
無菌試験	菌の発育を認めない	適合	適合	適合	—	—	—	—	—	—	適合	適合	適合
定量	95.0～105.0%	102.3%	101.6%	102.2%	100.9%	100.5%	101.0%	101.2%	101.9%	101.9%	101.2%	101.5%	102.4%

表 3：レボフロキサシン点眼液 0.5%「科研」の光安定性試験成績（保存条件：蛍光灯下）

包装	試験項目	時期 規格	試験開始時	総照度 30 万 lx・hr 時点	総照度 60 万 lx・hr 時点	総照度 120 万 lx・hr 時点
一次包装	性状	微黄色～淡黄色澄明の液	適合	黄色澄明の液	—	—
	pH	6.2～6.8	6.51	6.25	—	—
	不溶性異物試験	不溶性異物を認めない	適合	適合	—	—
	不溶性微粒子試験	平均微粒子数が 1mL 当たり 300μm 以上のものは 1 個以下である。	適合	適合	—	—
	定量	95.0～105.0%	101.5%	93.0%	—	—
最終包装	性状	微黄色～淡黄色澄明の液	適合	適合	適合	適合
	pH	6.2～6.8	6.51	6.45	6.45	6.49
	不溶性異物試験	不溶性異物を認めない	適合	適合	適合	適合
	不溶性微粒子試験	平均微粒子数が 1mL 当たり 300μm 以上のものは 1 個以下である。	適合	適合	適合	適合
	定量	95.0～105.0%	101.5%	102.4%	101.9%	102.2%

