

**【カルバン錠 25・50・100mg】
溶出試験に関する資料**

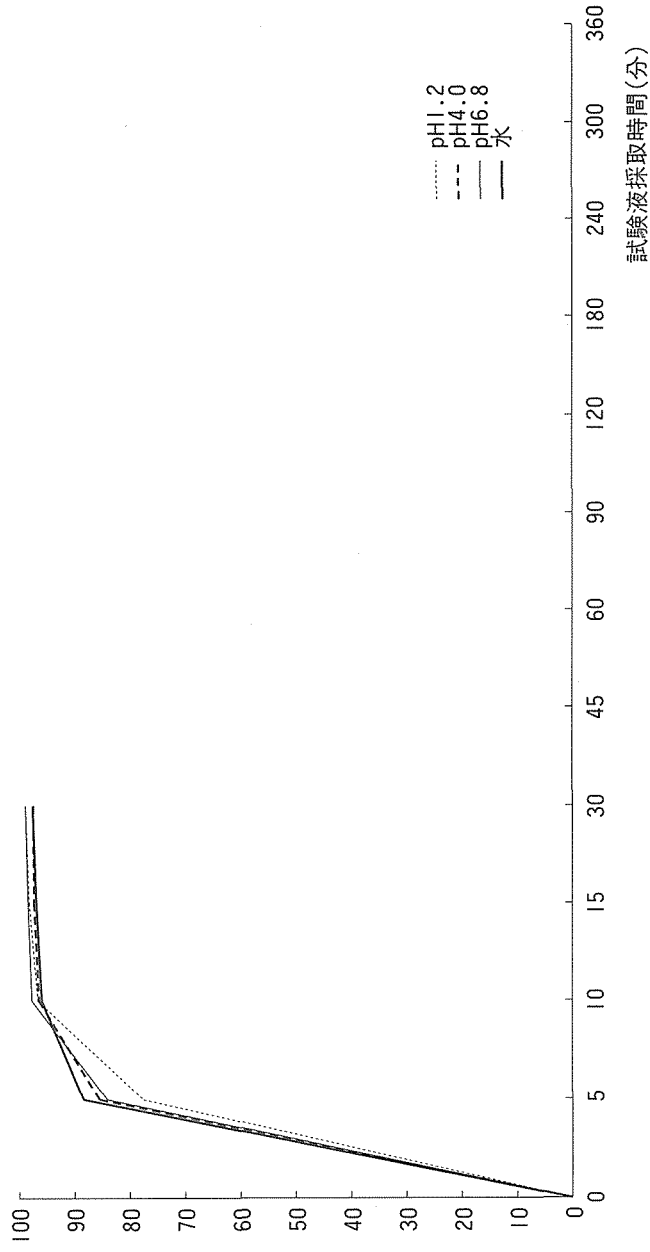
オレンジブック No.23 (H17年6月版)

日本ケミファ株式会社

溶出曲線測定例

塩酸ペバントロロール錠 2.5 mg

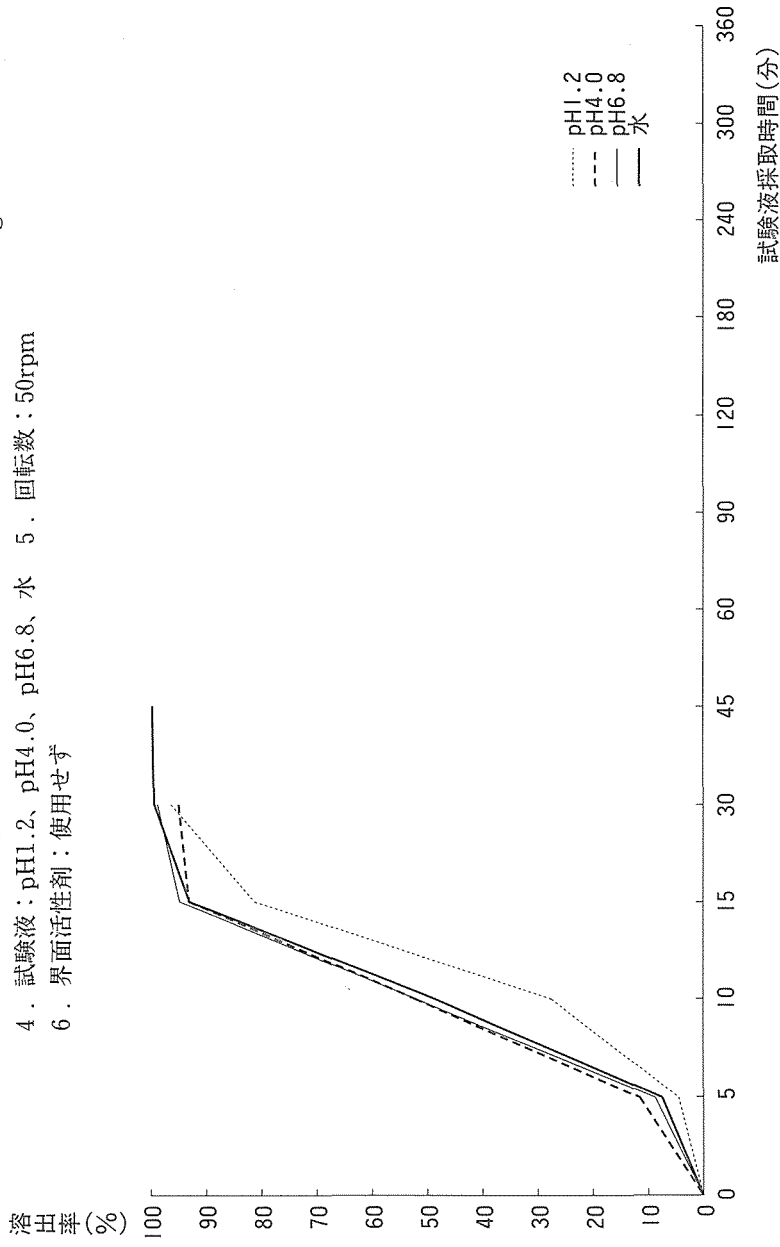
1. 有効成分名：塩酸ペバントロロール
2. 剤形：錠剤
3. 含量：25mg
4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
5. 回転数：50rpm
6. 界面活性剤：使用せず



溶出曲線測定例

塩酸ベバントロール錠 50 mg

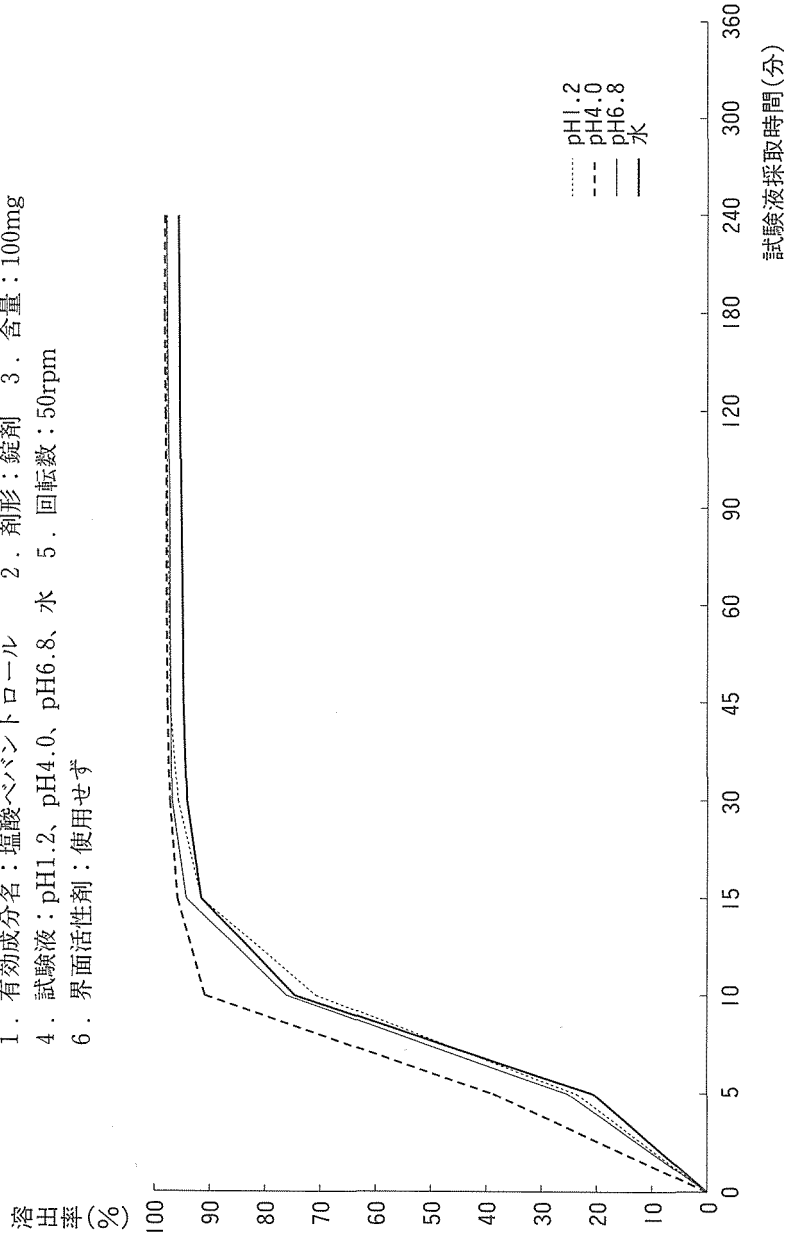
1. 有効成分名：塩酸ベバントロール
2. 剤形：錠剤
3. 含量：50mg
4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
5. 回転数：50rpm
6. 界面活性剤：使用せず



溶出曲線測定例

塩酸ペバントロロール錠 100mg

1. 有効成分名：塩酸ペバントロロール
2. 剤形：錠剤
3. 含量：100mg
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



物理化学的性質

塩酸ベバントロール

有効成分名	塩酸ベバントロール	
構造式		
解離定数 (25°C)	pKa : 8.36 (第二アミノ基、滴定法)	
溶解度 (37°C)	pH1.2 : 16.0mg/mL pH4.0 : 33.8mg/mL pH6.8 : 33.9mg/mL 水 : 30.6mg/mL	
安定性	水	なし
	液性 (pH)	なし
	光	なし
	その他	なし
備考	なし	

塩酸ベバントロール錠
Bevantolol Hydrochloride Tablets

溶出試験 本品1個をとり、試験液に水900mLを用い、溶出試験法第2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0.45 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10mLを除き、次のろ液V mLを正確に量り、表示量に従い1mL中に塩酸ベバントロール(C₂₀H₂₇NO₄・HCl)約28 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。別に塩酸ベバントロール標準品を105°Cで2時間乾燥し、その約0.028g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50mL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により試験を行い、波長277nmにおける吸光度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。

塩酸ベバントロール(C₂₀H₂₇NO₄・HCl)の表示量に対する溶出率(%)

$$= W_s \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{V'}{V} \times \frac{1}{C} \times 90$$

W_S : 塩酸ベバントロール標準品の量(mg)

C : 1錠中の塩酸ベバントロール(C₂₀H₂₇NO₄・HCl)の表示量(mg)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
25mg	15分	80%以上
50mg	15分	75%以上
100mg	15分	75%以上

塩酸ベバントロール標準品 C₂₀H₂₇NO₄・HCl : 381.89 (±)-1-[(3,4-ジメトキシフェネチル)アミノ]-3-(*m*-トリロキシ)-2-プロパノール塩酸塩で、下記の規格に適合するもの。必要な場合には次に示す方法により精製する。

精製法 塩酸ベバントロール10gを2-プロパノール/水混液(9:1)50mLに加熱して溶かし、熱時ろ過し、ろ液を冷所に一夜静置する。析出した結晶をろ取り、2-プロパノール/水混液(9:1)少量で洗う。同様の操作を1回繰り返す。得られた結晶をシリカゲルを乾燥剤として24時間減圧乾燥する。

性状 本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。

確認試験 本品を乾燥し、赤外吸収スペクトル測定法の臭化カリウム錠剤法により測定するとき、波数3330cm⁻¹、2960cm⁻¹、1602cm⁻¹、1268cm⁻¹、1029cm⁻¹及び

819 cm^{-1} 付近に吸収を認める.

融点 138~141 $^{\circ}\text{C}$

類縁物質 本品 0.10g をメタノール 5mL に溶かし、試料溶液とする. この液 1mL を正確に量り、メタノールを加えて正確に 100mL とする. この液 1mL を正確に量り、メタノールを加えて正確に 20mL とし、標準溶液とする. これらの液につき、薄層クロマトグラフ法により試験を行う. 試料溶液及び標準溶液 10 μL ずつを薄層クロマトグラフ用シリカゲルを用いて調製した薄層板にスポットする. 次にトルエン/エタノール(95)/酢酸(100)混液(14 : 4 : 1)を展開溶媒として約 12cm 展開した後、薄層板を風乾する. これに噴霧用 4-ジメチルアミノベンズアルデヒド試液を均等に噴霧し、105 $^{\circ}\text{C}$ で 15 分間加熱するとき、試料溶液から得た主スポット以外のスポットは、標準溶液から得たスポットより濃くない.

乾燥減量 1.0%以下(1g, 105 $^{\circ}\text{C}$, 2 時間).

含量 99.0%以上. 定量法 本品を乾燥し、その約 0.12g を精密に量り、酢酸(100)50mL 及び非水滴定用酢酸水銀(II)試液 2mL に溶かし、0.02mol/L 過塩素酸で滴定する(電位差滴定法). 同様の方法で空試験を行い、補正する.

0.02mol/L 過塩素酸 1mL = 7.638mg $\text{C}_{20}\text{H}_{27}\text{NO}_4 \cdot \text{HCl}$