

アジスロマイシン錠 250mg「DSEP」の 溶出性に関する資料

第一三共エスファ株式会社

【概要】

アジスロマイシン錠 250mg「DSEP」（アジスロマイシン水和物製剤）について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」^{*1)}の溶出試験の項に従って試験を行った結果、規定されたすべての溶出試験条件^{*2)}において判定基準に適合し、アジスロマイシン錠 250mg「DSEP」と標準製剤の溶出挙動は類似していることが検証された。

※1)：後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日付 薬食審査発第 1124004 号）

※2)：pH1.2（日本薬局方溶出試験第 1 液）/50rpm
pH5.0（薄めた McIlvaine の緩衝液）/50rpm、100rpm
pH6.8（日本薬局方溶出試験第 2 液）/50rpm 及び水/50rpm

1. 後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日付 薬食審査発第 1124004 号）」に基づき、試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」による。

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液
pH5.0 薄めた McIlvaine の緩衝液
pH6.8 日本薬局方溶出試験第 2 液
水 日本薬局方精製水

回転数：50rpm（pH1.2、pH5.0、pH6.8、水）、100rpm（pH5.0）

試験時間：pH1.2 では 2 時間、その他の試験液では 6 時間とする。ただし、標準製剤の平均溶出率が 85%を越えた時点で終了とすることができる。

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って類似性を判定した。

【pH1.2、50rpm】、【pH5.0、100rpm】：

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

【pH5.0、50rpm】：

標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 42 以上である。

【pH6.8、50rpm】：

標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 50%以上 85%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 46 以上である。

【水、50rpm】：

標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

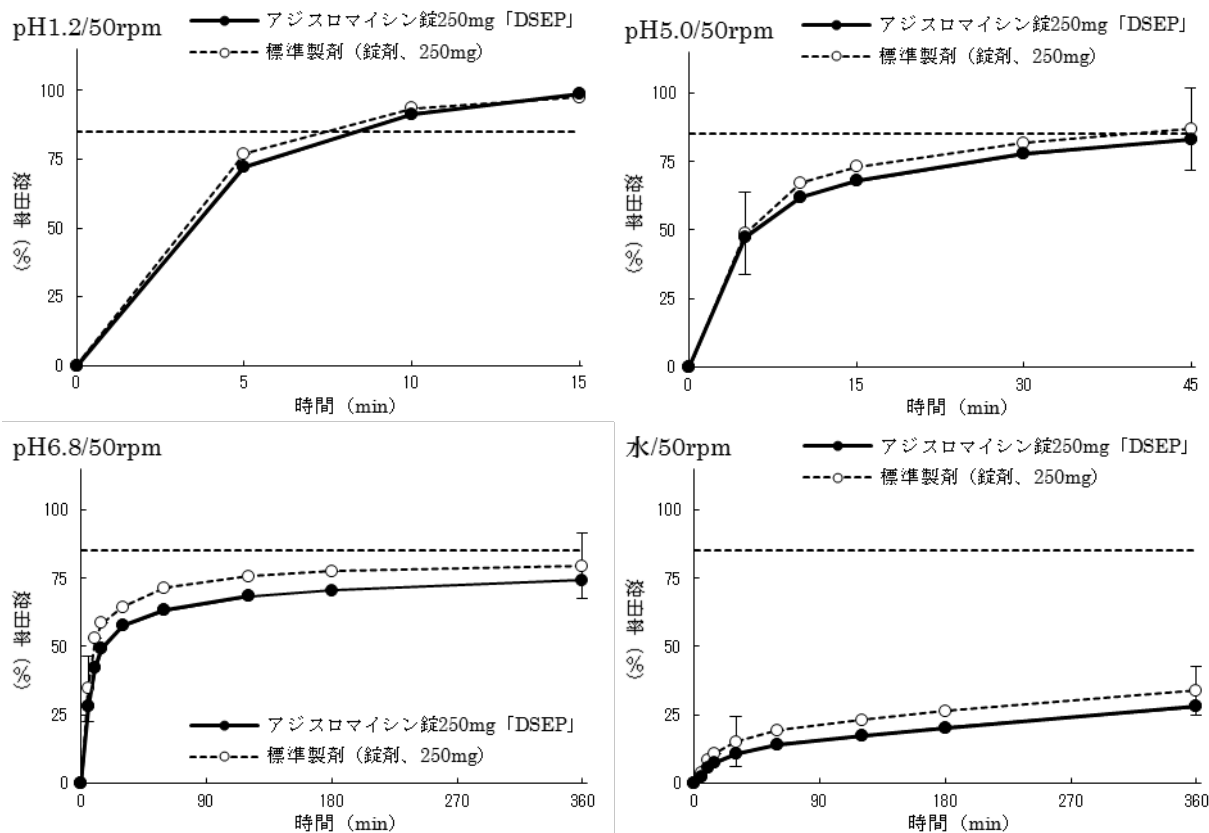
規定された試験時間において、標準製剤の平均溶出率が 50%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 53 以上である。

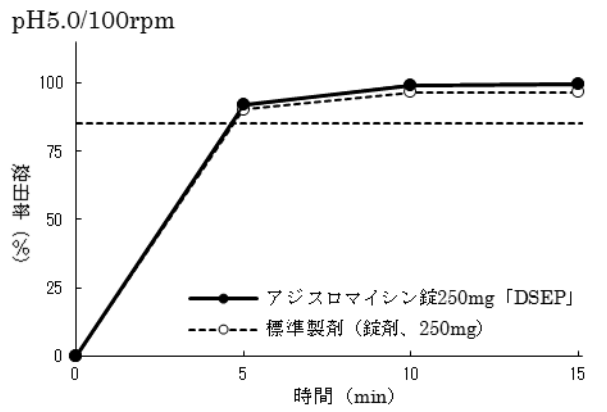
試験結果：すべての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

溶出挙動における類似性（アジスロマイシン錠 250mg 「DSEP」及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件	溶出時間 (分)	平均溶出率(%)			判定	判定基準 (アジスロマイシン錠 250mg 「DSEP」の溶出条件)	
		アジスロマイシン錠 250mg 「DSEP」	標準製剤 (錠剤、250mg)	差 (絶対値)			
50rpm	pH1.2	15	98.8	97.5	1.3	適	$\geq 85\%$ 又は $\pm 15\%$
	pH5.0	5	47.5	48.7	1.2	適	$\pm 15\%$ 又は f_2 関数 ≥ 42
		45	83.1	86.9	3.8		
	pH6.8	5	28.2	34.6	6.4	適	$\pm 12\%$ 又は f_2 関数 ≥ 46
		360	74.7	79.5	4.8		
	水	30	10.7	15.2	4.5	適	$\pm 9\%$ 又は f_2 関数 ≥ 53
360		28.0	33.9	5.9			
100rpm	pH5.0	15	99.7	96.6	3.1	適	$\geq 85\%$ 又は $\pm 15\%$

(溶出曲線)





2. 公的溶出試験

アジスロマイシン錠 250mg「DSEP」は、日本薬局方外医薬品規格第四部に定められたアジスロマイシン水和物錠の溶出規格に適合していることが確認された。

溶出規格					試験結果 (%)
表示量	試験液	回転数	規定時間	溶出率	
250mg	pH6.5 リン酸塩緩衝液	75rpm	30分	85%以上	88~102