

日本薬局方エパルレスタット錠

エパルレスタット錠 50mg 「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】

エパルレスタット錠 50mg「DSEP」（エパルレスタット製剤）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、エパルレスタット錠 50mg「DSEP」と標準製剤の溶出挙動は同等であると判定された。

※1)：後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成9年12月22日付 医薬審第487号、平成13年5月31日付 医薬審発第786号）

※2)：pH1.2（日本薬局方崩壊試験第1液）/50rpm
pH5.0（薄めた McIlvaine の緩衝液）/50rpm
pH6.8（日本薬局方崩壊試験第2液）/50rpm、100rpm 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（平成9年12月22日付 医薬審第487号、平成13年5月31日付 医薬審発第786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 日本薬局方崩壊試験第1液
pH5.0 薄めた McIlvaine の緩衝液
pH6.8 日本薬局方崩壊試験第2液
水 日本薬局方精製水

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

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、次の項目に従って同等性を判定した。

【pH1.2、50rpm】、【pH5.0、50rpm】、【水、50rpm】：

標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間以内に85%に達しない場合

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は標準製剤の平均溶出率±a%の範囲にある。aは、溶出率が50%以上の場合には15、50%未満の場合には8とする。又はf2関数の値は溶出率が50%以上の場合には50以上、50%未満の場合には55以上である。

【pH6.8、50rpm】：

標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間以内に85%に達する場合

標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

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は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。又はf2関数の値は45以上である。

【pH6.8、100rpm】：

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合

試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。又は、15分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

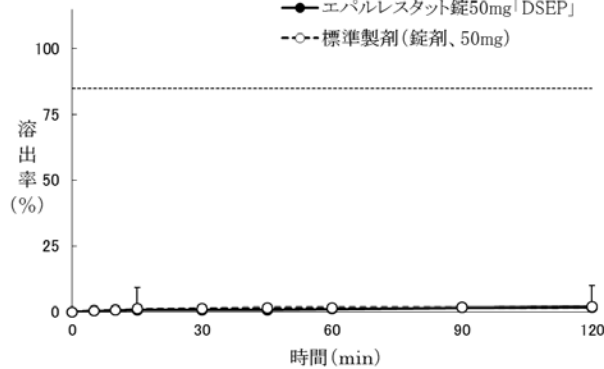
試験結果：すべての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

溶出挙動における同等性（エパルレストアット錠 50mg 「DSEP」 及び標準製剤の平均溶出率の比較）

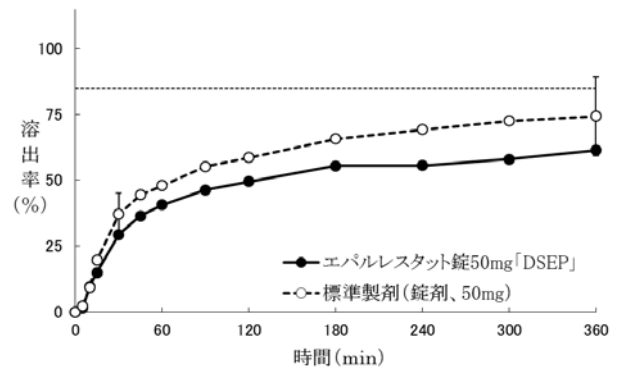
試験条件		溶出時間 (分)	平均溶出率 (%)			判定	判定基準 (エパルレストアット錠 50mg 「DSEP」 の溶出条件)
			エパルレストアット錠 50mg 「DSEP」	標準製剤 (錠剤、50mg)	差 (絶対値)		
50rpm	pH1.2	15	0.8	1.1	0.3	適	±8% 又は f2 関数 ≥ 55
		120	1.8	1.9	0.1		
	pH5.0	30	29.4	37.1	7.7	適	±15% 又は f2 関数 ≥ 50
		360	61.4	74.3	12.9		
	pH6.8	15	39.6	49.6	10.0	適	±15% 又は f2 関数 ≥ 45
		60	90.4	87.7	2.7		
水	30	20.1	16.8	3.3	適	±8% 又は f2 関数 ≥ 55	
	360	26.6	25.9	0.7			
100rpm	pH6.8	15	89.7	97.7	8.0	適	≥85% 又は ±15%

(溶出曲線)

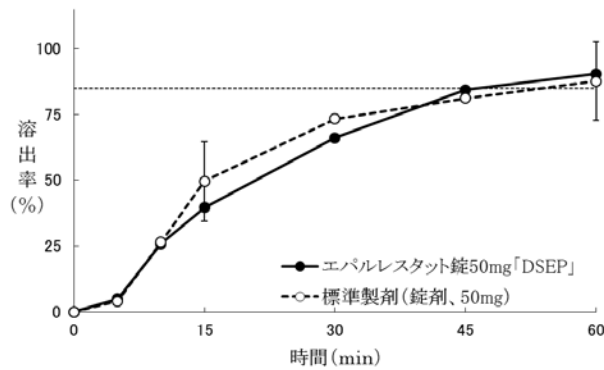
pH1.2/50rpm



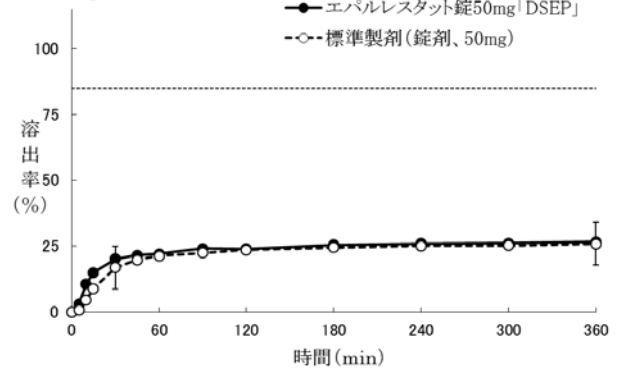
pH5.0/50rpm

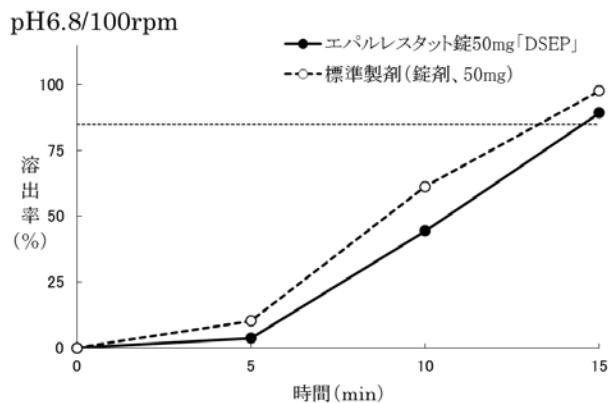


pH6.8/50rpm



水/50rpm





2. 公的溶出試験

エパルレスタット錠 50mg 「DSEP」は、日本薬局方医薬品各条に定められたエパルレスタット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	
50mg	pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液)	50rpm	45分	70%以上	96~100