

ボセンタン錠 62.5mg「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】

ボセンタン錠 62.5mg 「DSEP」 (ボセンタン製剤) 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、ボセンタン錠 62.5mg 「DSEP」は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、ボセンタン錠 62.5mg 「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 24 年 2 月 29 日付 薬食審査発 0229 第 10 号)

※2)： pH1.2 (日本薬局方溶出試験第 1 液) /50rpm
pH6.5 (薄めた McIlvaine の緩衝液) /50rpm
pH7.5 (薄めた McIlvaine の緩衝液) /50rpm、/100rpm 及び水/50rpm

1. 後発医薬品の生物学的同等性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 24 年 2 月 29 日付 薬食審査発 0229 第 10 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
pH6.5 薄めた McIlvaine の緩衝液
水 日本薬局方精製水
pH7.5 薄めた McIlvaine の緩衝液

回転数：50rpm (pH1.2、pH6.5、水、pH7.5)、100rpm (pH7.5)

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】：

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、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 10%以下の場合、規定された試験時間でのみ評価し、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にある。

【pH6.5、50rpm】、【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±9%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である。

【pH7.5、50rpm】、【pH7.5、100rpm】：

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 f2 関数の値が 42 以上である。

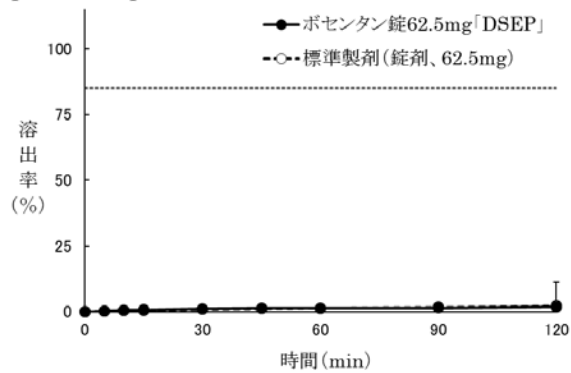
試験結果：すべての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

溶出挙動における類似性（ボセンタン錠 62.5mg「DSEP」及び標準製剤の平均溶出率の比較）

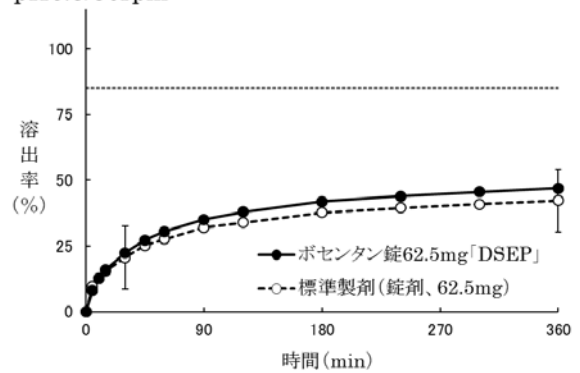
試験条件		溶出時間 (分)	平均溶出率 (%)			判定	判定基準 (ボセンタン錠 62.5mg「DSEP」の溶出条件)
			ボセンタン錠 62.5mg「DSEP」	標準製剤 (錠剤、62.5mg)	差 (絶対値)		
50rpm	pH1.2	120	1.9	2.3	0.4	適	±9%
		pH6.5	30	22.5	20.7	1.8	
	360		47.0	42.3	4.7	適	±9%又は f2 関数 ≥ 53
	水	10	7.9	9.1	1.2		
		360	21.2	17.9	3.3	適	
	pH7.5	5	32.4	32.8	0.4	適	±15%又は f2 関数 ≥ 42
60		77.4	85.2	7.8	適		
100rpm	pH7.5	5	48.2	40.7	7.5	適	
		45	95.3	85.5	9.8		

(溶出曲線)

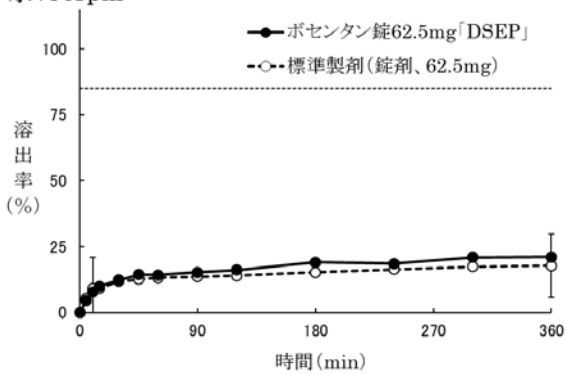
pH1.2/50rpm



pH6.5/50rpm



水 /50rpm



pH7.5/50rpm

