

メサラジン徐放錠250mg「JG」の溶出試験

1. 試験目的

メサラジン徐放錠250mg「JG」の溶出性における標準製剤との類似性を確認するために、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(薬食審査発第1124004号 平成18年11月24日, 別紙1)」に従い溶出試験を実施した。

2. 試験条件

試験法	回転数 (rpm)	試験液	PS※ 添加	温度 (°C)	試験液量 (mL)	ベッセル数	分析法
パドル法	50	pH1.2(日本薬局方 溶出試験第1液)	—	37±0.5	900	12	紫外可視吸光度測定法
		pH5.0(薄めたMcIlvaine緩衝液)	—				
		pH6.8(日本薬局方 溶出試験第2液)	—				
		水	—				
		pH6.8(日本薬局方 溶出試験第2液)	○				
	100	pH6.8(日本薬局方 溶出試験第2液)	—				
200	pH6.8(日本薬局方 溶出試験第2液)	—					
回転バスケット法	100	pH6.8(日本薬局方 溶出試験第2液)	—				
	200	pH6.8(日本薬局方 溶出試験第2液)	—				

※界面活性剤<ポリソルベート 80>1.0%添加

3. 判定基準

試験法	回転数 (rpm)	試験液	判定基準
パドル法	50	pH1.2	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f2関数の値が46以上である。
		pH5.0	標準製剤の平均溶出率が30%、50%、80%付近の適当な3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。
		pH6.8	
		水	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f2関数の値が46以上である。
	pH6.8+PS	標準製剤の平均溶出率が30%、50%、80%付近の適当な3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。	
100	pH6.8		
200	pH6.8		
回転バスケット法	100	pH6.8	標準製剤の平均溶出率が30%、50%、80%付近の適当な3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。
	200	pH6.8	

4. 試験結果

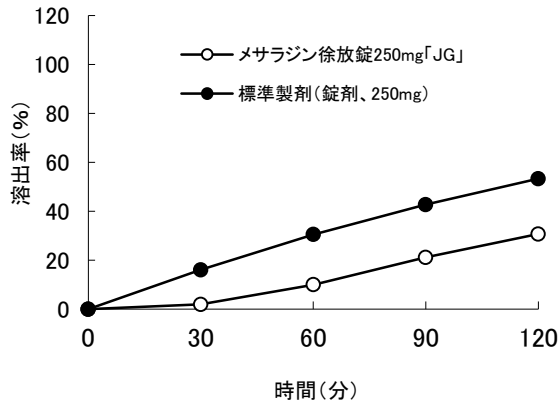
パドル法50rpmのpH5.0、pH6.8、水、pH6.8(ポリソルベート80 1.0%添加)、パドル法100rpm、200rpm及び回転バスケット法100rpmのpH6.8において判定時点での試験製剤の標準製剤との平均溶出率の差がそれぞれ判定基準に適合した。また、回転バスケット法200rpmのpH6.8では、判定時点における試験製剤の平均溶出率が判定基準を逸脱していたが、f2関数の値で適合と確認された。しかしながらパドル法50rpmのpH1.2においては判定基準に適合しなかった。

判定時点における平均溶出率

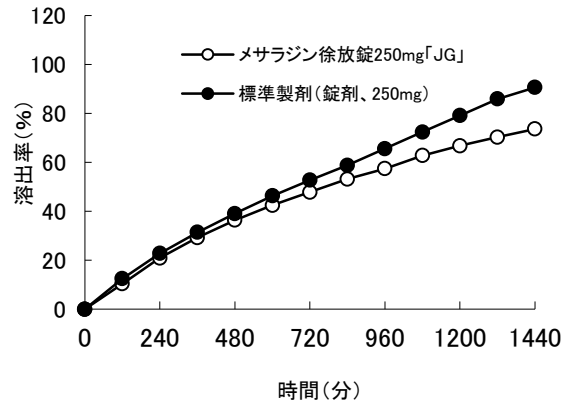
試験法	回転数 (rpm)	試験液	判定時点 (分)	溶出率(%)			f2値	判定	
				標準製剤	試験製剤	差			
パドル法	50	pH1.2	60分	30.5	10.0	-20.5	37.1	不適	
			120分	53.3	30.7	-22.6			
		pH5.0	360分	31.4	29.3	-2.1	—	適	
			720分	52.7	47.8	-4.9		適	
			1200分	79.1	66.8	-12.3		適	
		pH6.8	240分	32.8	32.2	-0.6	—	適	
			360分	45.3	45.3	0.0		適	
			840分	79.7	75.3	-4.4		適	
		水	720分	40.3	43.2	+2.9	—	適	
			1440分	68.9	66.5	-2.4		適	
		pH6.8 +PS	180分	27.1	24.9	-2.2	—	適	
			360分	46.8	48.0	+1.2		適	
	840分		80.5	78.8	-1.7	適			
	100	pH6.8	120分	27.8	29.1	+1.3	—	適	
			240分	46.9	51.6	+4.7		適	
			600分	81.5	79.4	-2.1		適	
	200	pH6.8	120分	32.2	39.9	+7.7	—	適	
			240分	51.9	62.6	+10.7		適	
			480分	76.9	83.4	+6.5		適	
	回転バスケット法	100	pH6.8	180分	31.8	41.6	+9.8	—	適
				300分	47.0	59.2	+12.2		適
720分				81.0	84.9	+3.9	適		
200		pH6.8	120分	27.0	38.1	+11.1	44.6	適	
			300分	52.1	68.5	+16.4			
			720分	83.2	88.8	+5.6			

溶出プロファイル

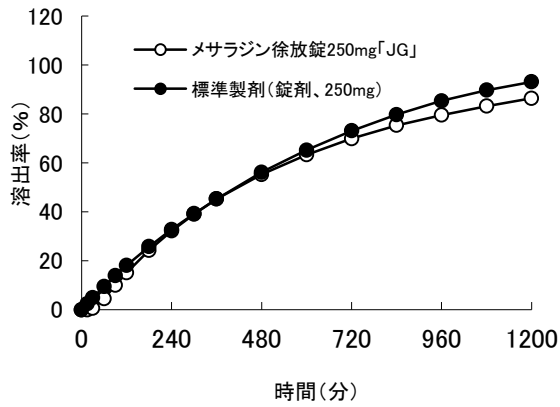
pH1.2、パドル法、50rpm



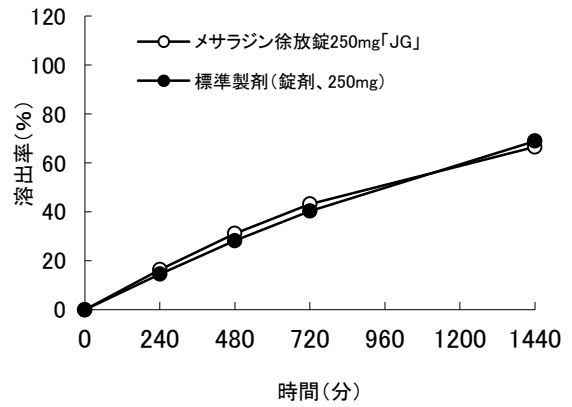
pH5.0、パドル法、50rpm



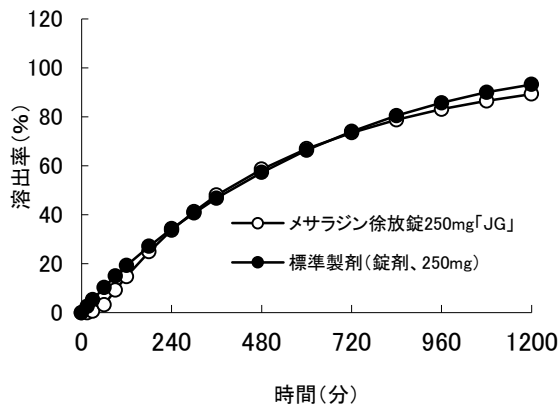
pH6.8、パドル法、50rpm



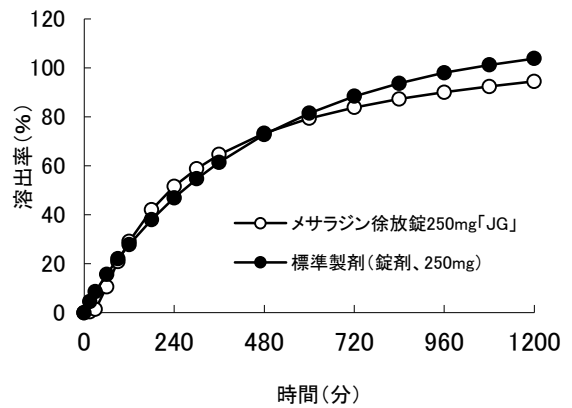
水、パドル法、50rpm



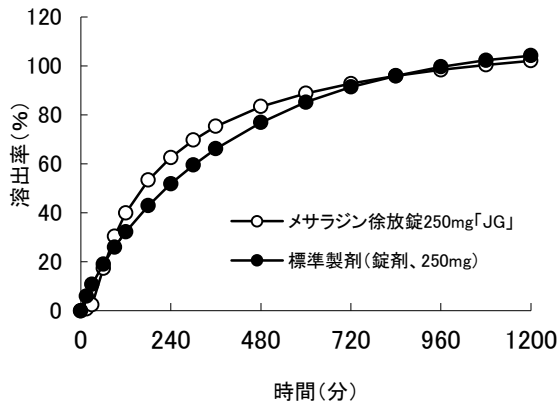
pH6.8+PS、パドル法、50rpm



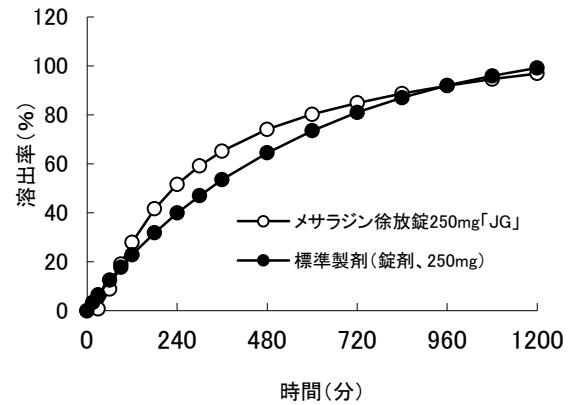
pH6.8、パドル法、100rpm



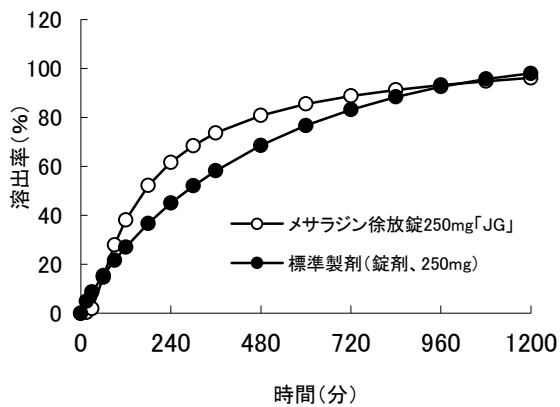
pH6.8、パドル法、200rpm



pH6.8、回転バスケット法、100rpm



pH6.8、回転バスケット法、200rpm



5. 結論

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従いメサラジン徐放錠250mg「JG」の溶出試験を実施した。パドル法50rpmのpH5.0、pH6.8、水、pH6.8(ポリソルベート80 1.0%添加)、100rpm及び200rpmのpH6.8並びに回転バスケット法100rpm及び200rpmのpH6.8では溶出挙動の類似性が確認されたが、パドル法50rpmのpH1.2では類似性が認められなかった。

なお、本製剤は生物学的同等性試験により標準製剤との同等性が確認されている。

令和2年1月

001