2024 年 12 月作成
シオノケミカル株式会社

ロフラゼプ酸エチル錠 1mg「SN」の溶出性に関する資料（品質再評価）

【はじめに】

ロフラゼプ酸エチル製剤であるロフラゼプ酸エチル錠 1mg「SN」とメイラックス錠 1mg との溶出挙動の類似性を検討するため、品質再評価で指定された 4 種類の試験液を用いて溶出試験を実施し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 13 年 5 月 31 日　医薬審発第 786 号）」に従い判定を行った。

【試験内容】

製剤	試験製剤：ロフラゼプ酸エチル錠 1mg「SN」 標準製剤：メイラックス錠 1mg
試験方法	日本薬局方　一般試験法　溶出試験法　パドル法
試験液（回転数）	50rpm：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水 900mL、37.0±0.5℃
ベッセル数	6 ベッセル
測定方法	液体クロマトグラフィー

【試験結果】

試験製剤と標準製剤の平均溶出率を次頁に示した。

回転数（rpm）		50			
試験液		pH1.2	pH4.0	pH6.8	水
判定時間（min）		15	15	15	15
平均溶出率	試験製剤（%）	89.2	91.3	94.9	90.6
	標準製剤（%）	85.3	91.0	96.0	99.0
差（%）		3.9	0.3	-1.1	-8.4
判定基準注)		1）-a-①	1）-a-①	1）-a-①	1）-a-①
判定		適合	適合	適合	適合

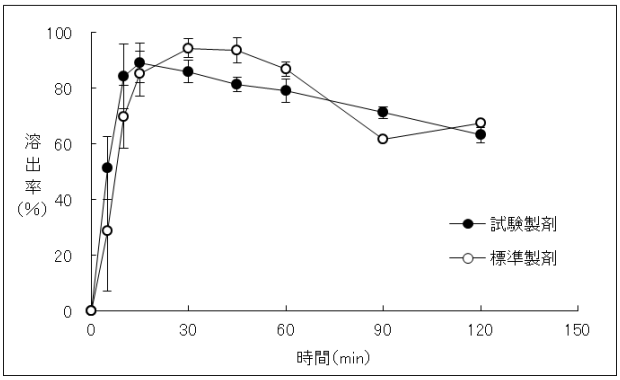
注）【溶出挙動の類似性の判定】参照

【結論】

品質再評価に指定された条件に従い、ロフラゼプ酸エチル錠 1mg「SN」とメイラックス錠 1mg との溶出挙動の類似性を検討するため溶出試験を行った結果、4 条件全てにおいて判定基準に適合した。従って、両製剤の溶出挙動は類似していると判定した。

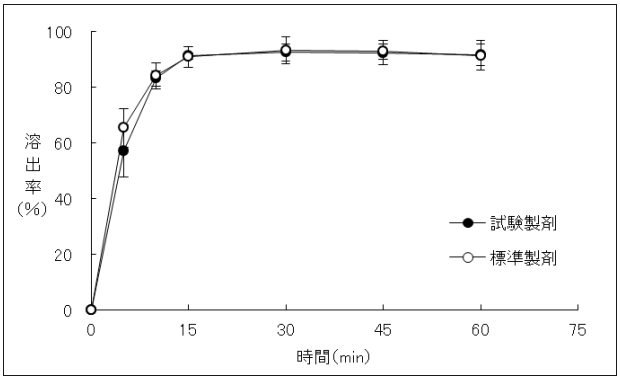
各試験条件における試験製剤及び標準製剤の平均溶出率（Mean±S.D., n=6）

1.pH1.2、50rpm



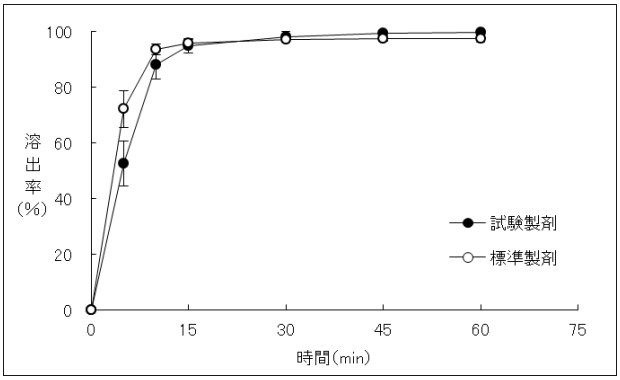
製剤	時間(min)	0	5	10	15	30	45	60	90	120
試験製剤	平均溶出率(%)	0	51.4	84.3	89.2	85.9	81.4	79.0	71.2	63.2
	標準偏差(%)	0	11.3	11.8	7.1	4.1	2.7	4.1	2.0	2.7
標準製剤	平均溶出率(%)	0	28.8	69.7	85.3	94.4	93.6	86.9	61.6	67.4
	標準偏差(%)	0	21.6	11.3	8.0	3.3	4.4	2.6	12.4	2.0

2.pH4.0、50rpm



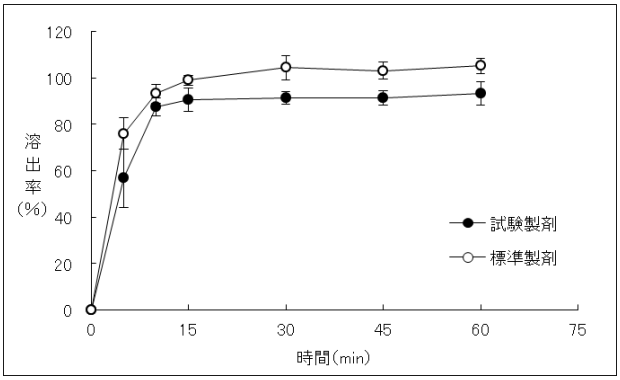
製剤	時間(min)	0	5	10	15	30	45	60
試験製剤	平均溶出率(%)	0	57.2	83.2	91.3	92.6	92.4	91.6
	標準偏差(%)	0	9.4	2.7	1.1	3.1	4.3	3.9
標準製剤	平均溶出率(%)	0	65.4	84.1	91.0	93.3	92.9	91.4
	標準偏差(%)	0	6.8	4.6	3.7	4.8	2.7	5.4

3.pH6.8、50rpm



製剤	時間(min)	0	5	10	15	30	45	60
試験製剤	平均溶出率(%)	0	52.7	88.0	94.9	98.2	99.3	99.6
	標準偏差(%)	0	8.0	5.1	2.6	1.8	2.4	1.7
標準製剤	平均溶出率(%)	0	72.2	93.5	96.0	97.2	97.5	97.5
	標準偏差(%)	0	6.6	1.9	1.1	0.7	0.9	1.3

4.水、50rpm



製剤	時間(min)	0	5	10	15	30	45	60
試験製剤	平均溶出率(%)	0	56.9	87.7	90.6	91.4	91.3	93.4
	標準偏差(%)	0	12.7	3.9	5.0	2.8	3.1	5.1
標準製剤	平均溶出率(%)	0	76.1	93.2	99.0	104.4	103.2	105.2
	標準偏差(%)	0	6.8	4.0	2.1	5.2	3.8	3.2

【溶出挙動の類似性の判定】
判定基準：後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン
（平成 13 年 5 月 31 日　医薬審発第 786 号）

1）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

a.標準製剤の溶出に明確なラグ時間がない場合：

①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。

②標準製剤が 15 分～30 分に平均 85%以上溶出する場合：標準製剤の平均溶出率が 60%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。

③上記以外の場合：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。

b.標準製剤の溶出にラグ時間がある場合：

①溶出ラグ時間以降 15 分以内に標準製剤が平均 85%以上溶出する場合：平均溶出ラグ時間の差が 10 分以内である。また、溶出ラグ時間以降試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は、溶出ラグ時間以降 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。

②溶出ラグ時間以降 15 分～30 分に標準製剤が平均 85%以上溶出する場合：平均溶出ラグ時間の差が 10 分以内であり、且つ、標準製剤の平均溶出率が 60%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。

③上記以外の場合：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。
溶出に遅れのあるときには、便宜上、ラグ時間を薬物が 5%溶出するまでの時間で表す。

2）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。