

【概要】

モンテルカスト OD 錠 10mg 「明治」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」の溶出試験の項に従って試験を行った結果、溶出挙動はシングレア®錠 10mg と類似ではないと判定された。

【試験方法】

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出試験の項に従って試験を実施した。

試験方法： 日本薬局方 溶出試験法 パドル法

試験条件

試験液量・温度 : 900mL、37±0.5℃

試験液 : ポリソルベート 80 無添加

- ①pH1.2 (日局溶出試験 第1液)
- ②pH4.0 (薄めた McIlvaine の緩衝液)
- ③pH6.8 (日局溶出試験 第2液)
- ④水

0.01%ポリソルベート 80 添加

- ⑤pH1.2 (日局溶出試験 第1液)
- ⑥pH4.0 (薄めた McIlvaine の緩衝液)
- ⑦pH6.8 (日局溶出試験 第2液)

回転数 : 50 回転 (試験液①~⑦)、100 回転 (試験液⑦)

【試験結果】

試験製剤の溶出挙動は [①pH1.2、②pH4.0、③pH6.8、⑤pH1.2 (0.01%) : 毎分 50 回転] 及び [⑦pH6.8 (0.01%) : 毎分 100 回転] においてはガイドラインに示された基準に適合したが、[④水、⑥pH4.0 (0.01%)、⑦pH6.8 (0.01%) : 毎分 50 回転] においては不適合であった。以上のことから、試験製剤の溶出挙動は標準製剤の溶出挙動と類似ではないと判定した。

溶出挙動における類似性 (モンテルカスト OD 錠 10mg 「明治」とシングレア®錠 10mg の平均溶出率の比較)

試験条件		比較時点	平均溶出率 (%)		判定*	
回転数	試験液		標準製剤 シングレア®錠 10mg	試験製剤 モンテルカスト OD 錠 10mg 「明治」		
50 回転	ポリソルベート 80 無添加	30 分	17.2	16.0	適合	
			120 分	32.0		27.1
		360 分	1.1	1.7	適合	
			③pH6.8	15 分	28.7	32.6
		60 分	31.1	33.1		
		④水	15 分	71.2	62.9	不適合
	30 分		80.0	57.1		
	0.01% ポリソルベート 80 添加	⑤pH1.2	45 分	23.2	22.6	適合
			120 分	45.7	28.1	
				f2=59		
⑥pH4.0		90 分	16.6	7.7	不適合	
		360 分	37.0	9.3		
⑦pH6.8		15 分	48.9	51.0	不適合	
	180 分	85.0	62.1			
100 回転	⑦pH6.8	15 分	54.2	60.6	適合	
		120 分	86.5	71.9		

* : それぞれの試験条件における判定基準は、【判定基準】の項を参照

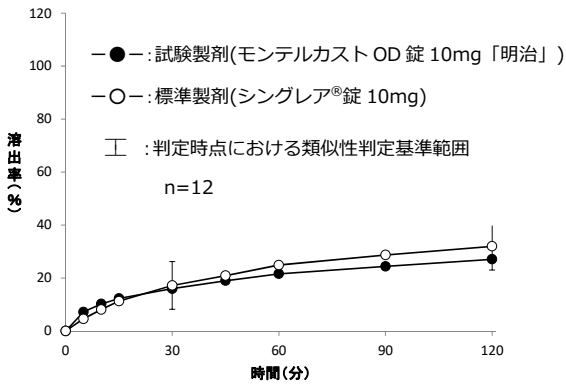
(n=12)

モンテルカスト OD 錠 10mg 「明治」の溶出試験に関する資料

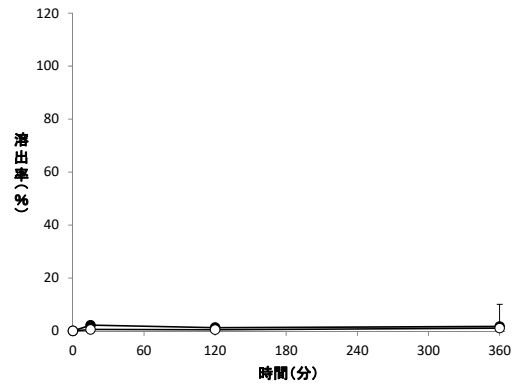


Meファルマ株式会社

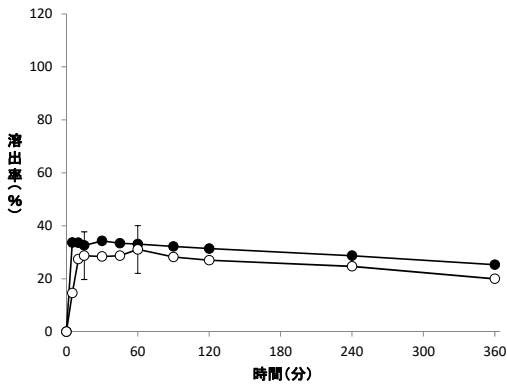
①ポリソルベート80無添加：pH1.2（50回転）



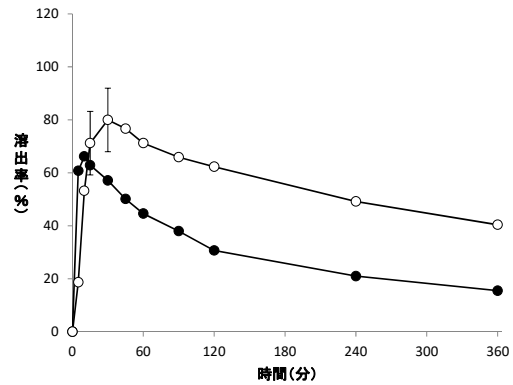
②ポリソルベート80無添加：pH4.0（50回転）



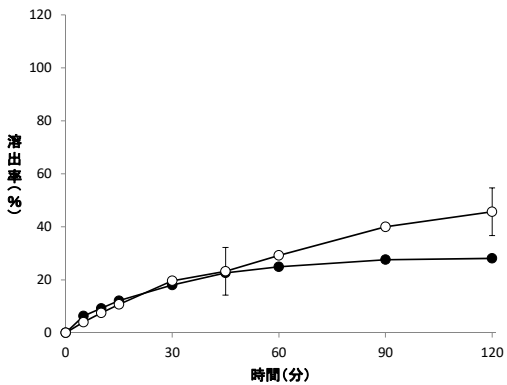
③ポリソルベート80無添加：pH6.8（50回転）



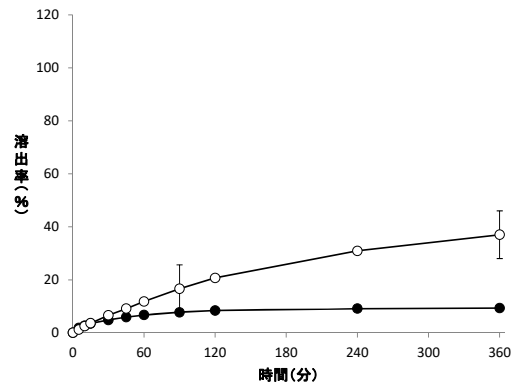
④ポリソルベート80無添加：水（50回転）



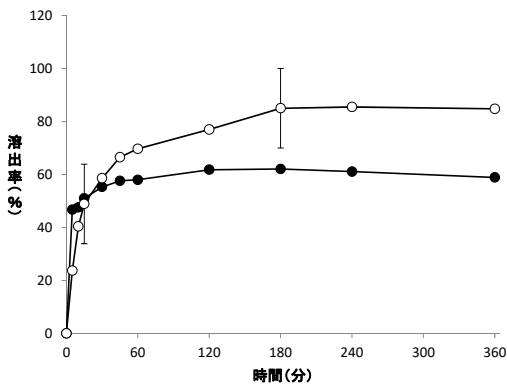
⑤0.01%ポリソルベート80添加：pH1.2（50回転）



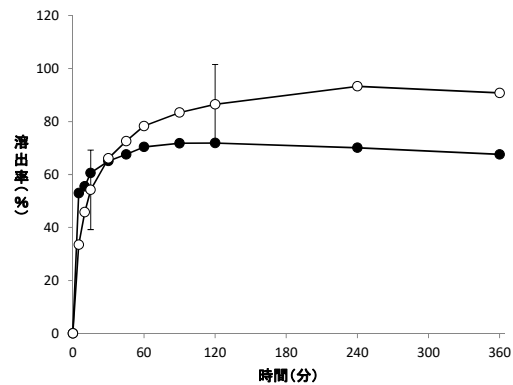
⑥0.01%ポリソルベート80添加：pH4.0（50回転）



⑦0.01%ポリソルベート80添加：pH6.8（50回転）



⑧0.01%ポリソルベート80添加：pH6.8（100回転）



モンテルカスト OD 錠 10mg 「明治」の溶出挙動における類似性

【判定基準】

平均溶出率

ポリソルベート 80 無添加

<①pH1.2 (50 回転)、③pH6.8 (50 回転) >

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 f2 関数の値が 53 以上である。

<②pH4.0 (50 回転) >

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 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 \pm 9%の範囲にある。

<④水 (50 回転) >

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 \pm 12%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 46 以上である。

0.01%ポリソルベート 80 添加

<⑤pH1.2 (50 回転)、⑥pH4.0 (50 回転) >

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 f2 関数の値が 53 以上である。

<⑦pH6.8 (50 回転)、⑦pH6.8 (100 回転) >

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%以上となると、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 \pm 15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値は 42 以上である。

【準拠したガイドライン】

・「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 0229 第 10 号 (平成 24 年 2 月 29 日付)