

ブシラミン錠 100mg 「KN」 の生物学的同等性に関する資料

～血中濃度測定結果 (*in vivo*) 及び溶出試験結果 (*in vitro*)～



小林化工株式会社

ブシラミン錠 100mg「KN」の生物学的同等性に関する資料
—血中濃度測定結果—

1. 試験方法

ブシラミン錠 100mg「KN」及び標準製剤を健康成人男子 15 名にそれぞれ 1 錠(ブシラミン 100mg) 経口投与したときのブシラミンの血中動態を比較し、両剤の生物学的同等性について検討した(クロスオーバー法)。

2. 試料製剤

試験製剤：ブシラミン錠100mg「KN」 (Lot No. BUC100-04)

性状：白色の糖衣錠

含量：1錠中、日局ブシラミン100mg含有

標準製剤：同成分含有製剤 (Lot No. RM1189)

性状：白色、糖衣錠

含量：1錠中、ブシラミン100mg含有

3. 測定方法

血中ブシラミン濃度の定量は、LC/MS/MS法により行った。

4. 試験結果

測定結果を図及び表に示した。

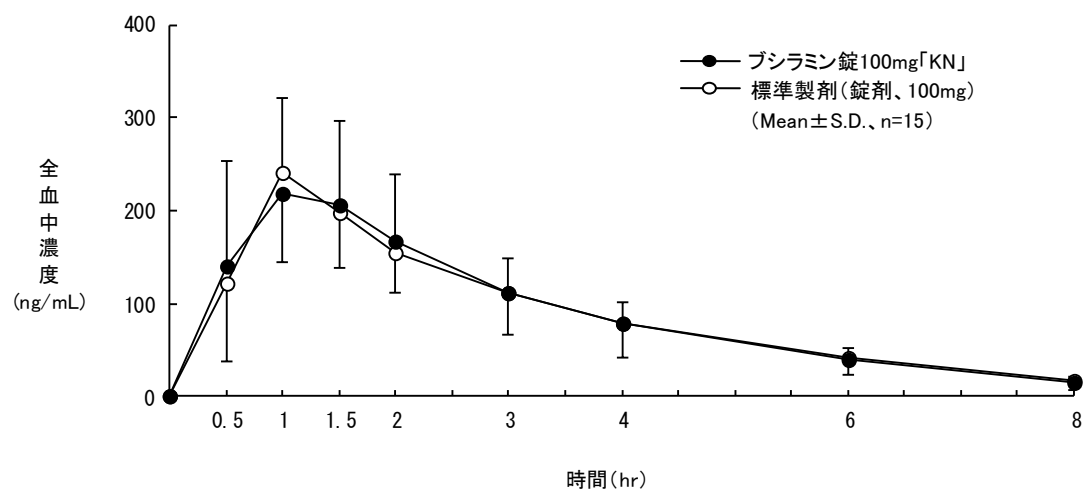


図 ブシラミン錠100mg「KN」又は標準製剤をヒトに単回経口投与したときの
全血中ブシラミン濃度推移

表 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→8hr} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ブシラミン錠100mg「KN」	734.16±243.18	259.57±82.92	0.9±0.4	1.8±0.4
標準製剤(錠剤、100mg)	725.43±161.44	256.20±67.20	0.9±0.4	1.8±0.3

(Mean±S. D.、n=15)

5. 考察

血中濃度測定の結果、ブシラミン錠100mg「KN」と標準製剤は生物学的に同等であると判断した。

ブシラミン錠 100mg「KN」の生物学的同等性に関する資料
— 溶出試験結果 —

1. 試験方法

ブシラミン錠100mg「KN」及び標準製剤について、各種pH溶出液における溶出試験を行い、両剤の溶出性について検討した。

2. 試料製剤

試験製剤：ブシラミン錠100mg「KN」(Lot No. BUC100-04)

性状：白色の糖衣錠

含量：1錠中、日局ブシラミン100mg含有

標準製剤：同成分含有製剤(Lot No. RM1189)

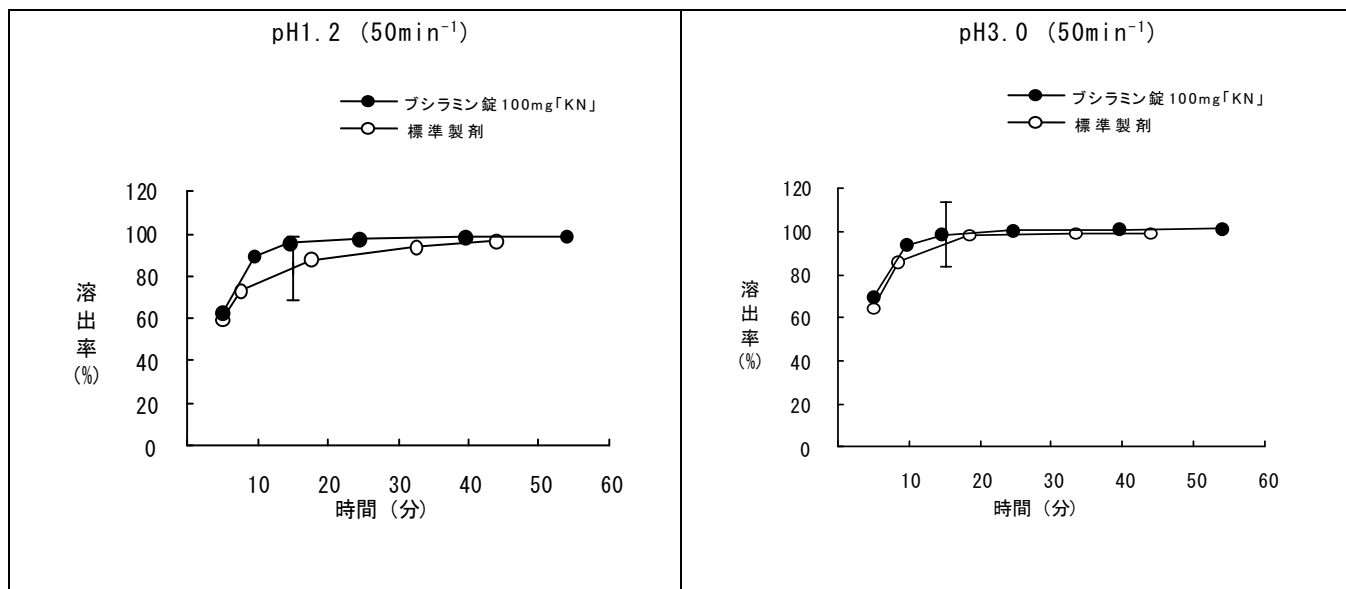
性状：白色、糖衣錠

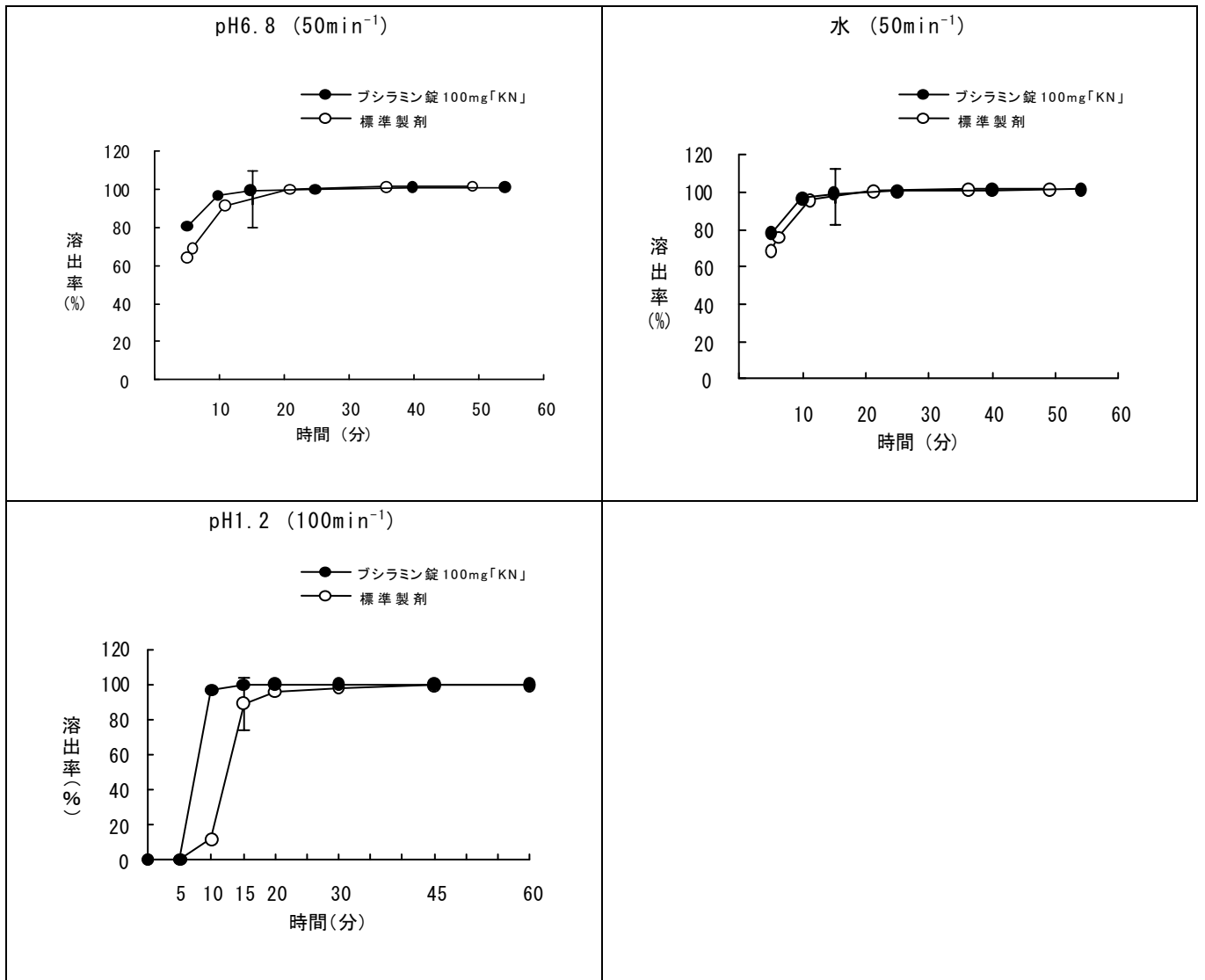
含量：1錠中、ブシラミン100mg含有

3. 測定方法

ブシラミンの定量は液体クロマトグラフィーにより試験を行い、表示量に対する溶出率(%)を算出し、この値を用いて溶出曲線を作成した(n=12)。

4. 試験結果





<判定基準>

pH1.2(50min⁻¹), pH3.0(50min⁻¹), pH6.8(50min⁻¹), 水(50min⁻¹)

標準製剤及び試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における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。

※標準製剤及び試験製剤にラグ時間が認められたことから、両剤のラグ時間補正後の溶出曲線について同等性の判定を行った。

pH1.2(100min⁻¹)

標準製剤及び試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出するか、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。

5. 考察

ピリドキシン塩100mg「KN」の溶出挙動はいずれの試験条件においても標準製剤とほぼ一致しており、両剤の溶出挙動は類似していることが確認された。

ブシラミン錠 100mg「KN」の生物学的同等性に関する資料
— 溶出試験結果（処方変更前後の比較） —

1. 試験方法

ブシラミン錠100mg「KN」（処方変更後）及び同剤（処方変更前）について、各種pH溶出液における溶出試験を行い、処方変更前後における両剤の溶出性について検討した。

2. 試料製剤

試験製剤：ブシラミン錠100mg「KN」（処方変更後）（Lot No. BUC100-04）

性状：白色の糖衣錠

含量：1錠中、日局ブシラミン100mg含有

標準製剤：ブシラミン錠100mg「KN」（処方変更前）（Lot No. T8DE02）

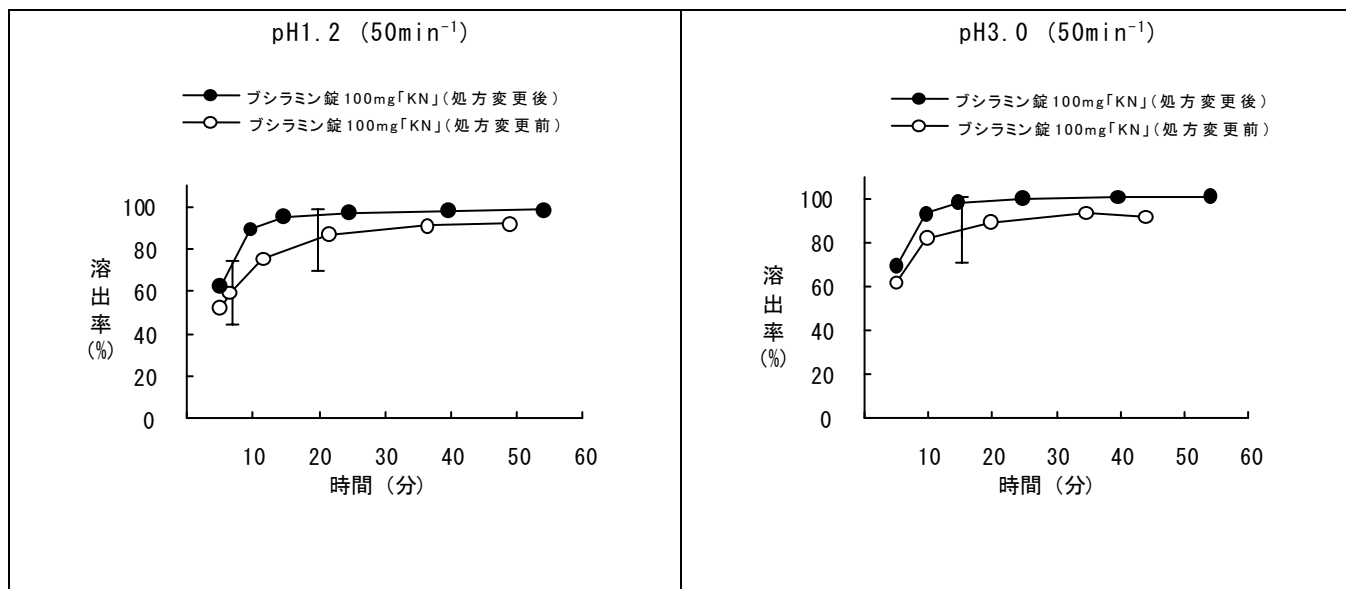
性状：白色の糖衣錠

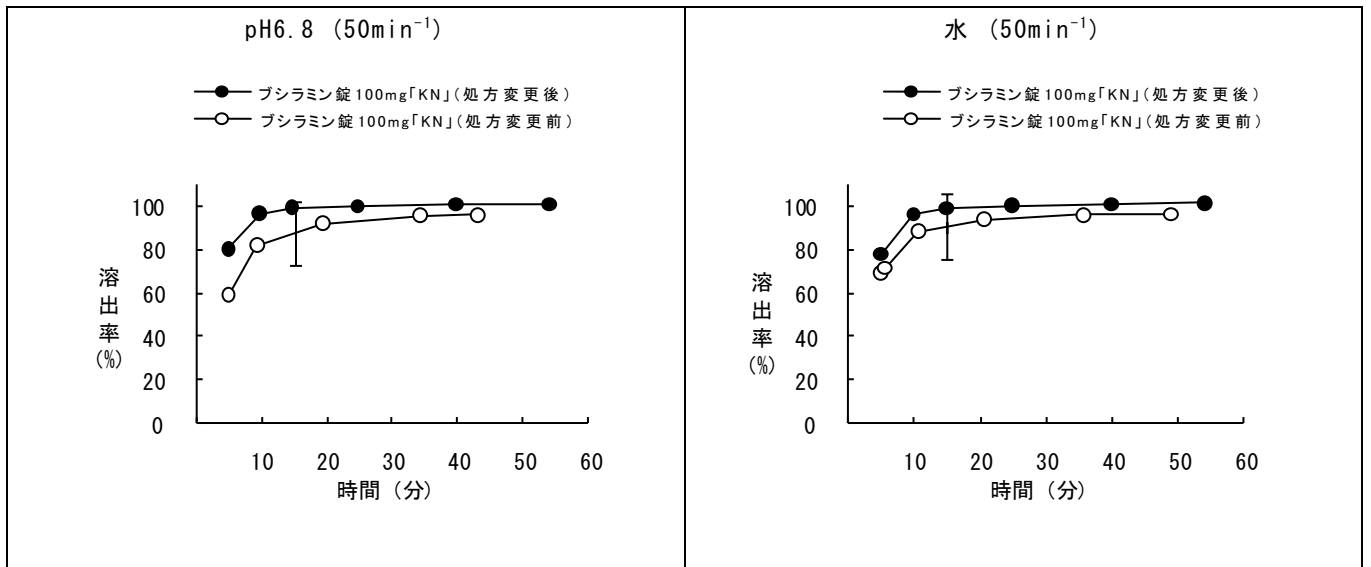
含量：1錠中、日局ブシラミン100mg含有

3. 測定方法

ブシラミンの定量は液体クロマトグラフィーにより試験を行い、表示量に対する溶出率(%)を算出し、この値を用いて溶出曲線を作成した（n=12）。

4. 試験結果





<判定基準>

pH3.0, pH6.8, 水

標準製剤及び試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における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。

※標準製剤及び試験製剤にラグ時間が認められたことから、両剤のラグ時間補正後の溶出曲線について同等性の判定を行った。

pH1.2

標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近となる適当な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。

※標準製剤及び試験製剤にラグ時間が認められたことから、両剤のラグ時間補正後の溶出曲線について同等性の判定を行った。

5. 考察

ブシラミン錠100mg「KN」の処方変更前後での溶出挙動はいずれの試験条件においてもほぼ一致しており、両剤の溶出挙動は類似していることが確認された。