

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」の溶出試験に関する資料

全星薬品工業株式会社
医薬情報部

「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号)による製剤比較試験

1. 検体

試験製剤：モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」(ロット番号：MSP2.5-R001)

標準製剤：モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」(ロット番号：MSP5-R002)

2. 溶出試験法

試験製剤の標準製剤に対する処方変更水準はC水準であったため、C水準における溶出試験を行った。

試験方法：日本薬局方一般試験法・パドル法

投入錠数：試験製剤、標準製剤各1錠/ベッセル

試験条件：回転数：50rpm

試験液：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水

試験液量：900mL

回転数：100rpm

試験液：pH6.8

試験液量：900mL

測定法：紫外可視吸光度測定法(波長：273nm)

3. 結果

溶出試験の結果は図1～5及び表1・表2に示す通りであった。

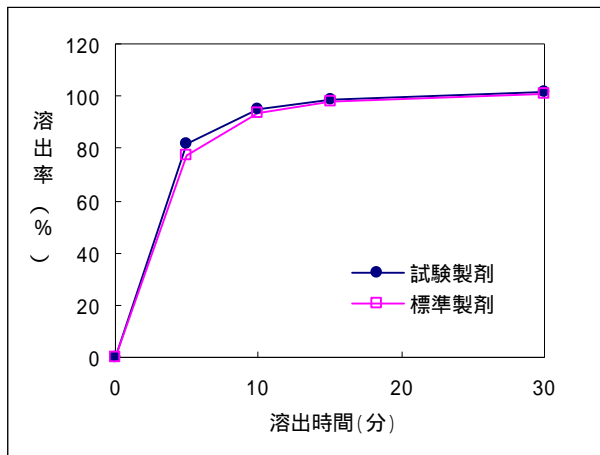


図1 pH1.2(50rpm)における平均溶出率

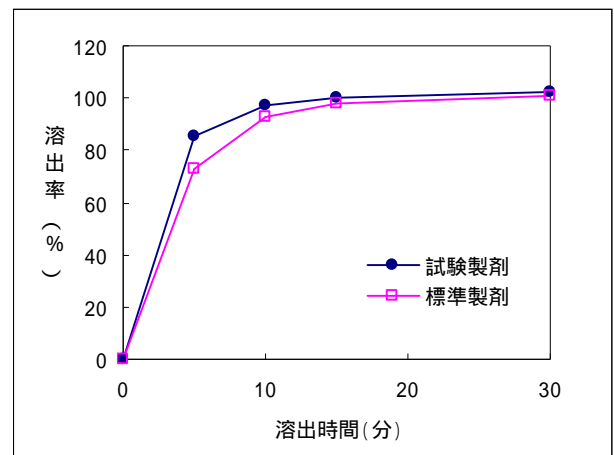


図2 pH3.0(50rpm)における平均溶出率

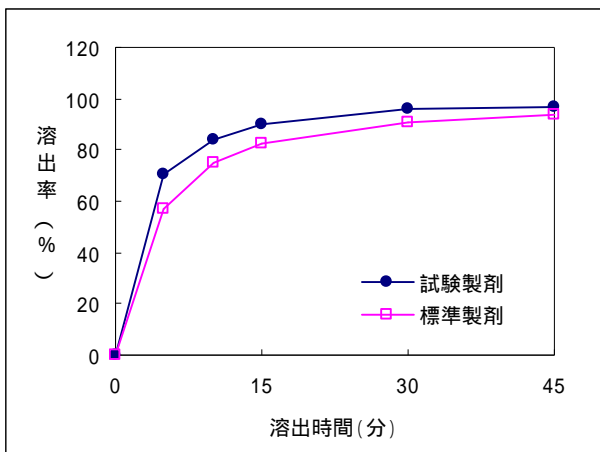


図3 pH6.8(50rpm)における平均溶出率

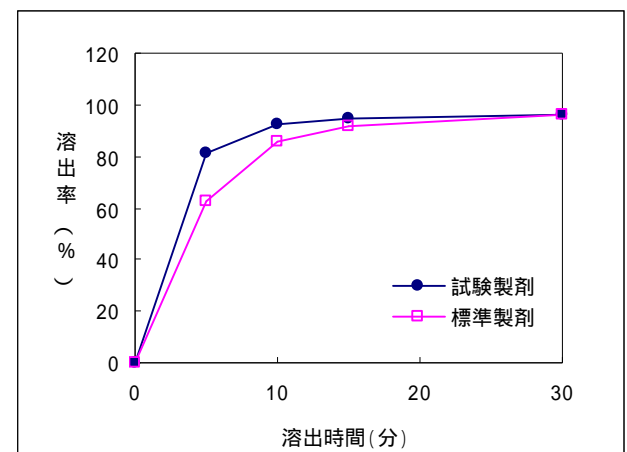


図4 水(50rpm)における平均溶出率

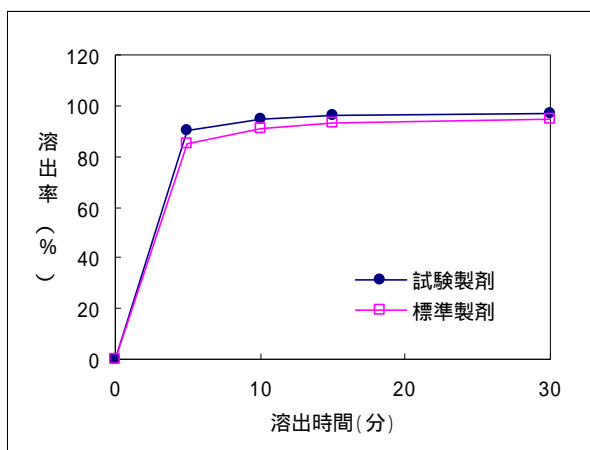


図5 pH6.8(100rpm)における平均溶出率

表1 溶出挙動の同等性の判定結果

装置	パドル法					
	50				100	
回転数(rpm)					100	
試験液	pH1.2	pH3.0	pH6.8		水	pH6.8
ガイドラインの判定基準分類						
採取時間(min)	15	15	5	15	15	15
標準製剤(%)	98.2	97.7	57.0	82.3	91.7	93.3
試験製剤(%)	99.0	100.3	70.3	89.9	94.4	96.4
f2 関数	-	-	61.8		-	-
判定	適合	適合	適合		適合	適合

< 判定条件及び判定基準 >

: 標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合で、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 $\pm 10\%$ の範囲にある。

: 標準製剤が 15 ~ 30 分に平均 85%以上溶出する場合で、標準製剤の平均溶出率が約 60%及び 85%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 $\pm 10\%$ の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 50 以上である。

表2 溶出挙動の同等性の判定結果 (個々の溶出率)

試験条件	最終比較時点 (min.)	試験製剤の平均溶出率(%)	試験製剤の個々の溶出率		判定基準	判定
			最小値(%)	最大値(%)		
50rpm	pH1.2	99.0	95.5	101.9	a	適合
	pH3.0	100.3	96.8	105.1	a	適合
	pH6.8	89.9	85.4	94.6	a	適合
	水	94.4	91.0	98.4	a	適合
100rpm	pH6.8	96.4	95.3	97.2	a	適合

< 判定条件及び判定基準 >

a. : 標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがない。

・日本薬局方医薬品各条「モサプリドクエン酸塩錠」の規格に対する適合性

1. 検体

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」（1錠中、モサプリドクエン酸塩 2.5mg 含有）3 ロット
(MSP2.5-R001、MSP2.5-R002、MSP2.5-R003)

2. 溶出性（日本薬局方医薬品各条「モサプリドクエン酸塩錠」による）

試験方法：日本薬局方一般試験法・パドル法

試験条件：回 転 数：50rpm

試 験 液：pH6.8

試験液量：900mL

測 定 法：液体クロマトグラフィー（波長：274nm）

溶出規格：

測定時間	溶出率
45 分	80%以上

3. 結果

溶出試験の結果は表3に示すとおりであり、いずれのロットも溶出規格に適合した。

表3 溶出試験結果（n=6）

ロット 番 号	回 数	溶出率(%)（最小値～最大値）
		45 分
MSP2.5-R001	1	97.7～101.4
	2	96.6～100.0
	3	98.2～99.2
MSP2.5-R002	1	92.4～101.5
	2	98.7～100.6
	3	96.6～100.9
MSP2.5-R003	1	98.2～103.5
	2	100.0～101.7
	3	99.0～101.1

・結論

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」は、いずれの条件下においても「含量が異なる経口固形製剤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、溶出パターンも類似することから、モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」と製剤学的に同等であると考えられた。また、日本薬局方医薬品各条「モサプリドクエン酸塩錠」の規格に適合した。

以 上