

クラリスロマイシン錠 200mg「フェルゼン」

溶出性に関する資料

<試験条件>

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」(2001年5月31日付 医薬審発第786号)

試験製剤 クラリスロマイシン錠 200mg「フェルゼン」

試験法 日局 溶出試験法 (パドル法)

試験液量 900 mL (温度: $37 \pm 0.5^\circ\text{C}$)

試験液 pH1.2: 日本薬局方溶出試験第1液

pH3.0: 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8: 日本薬局方溶出試験第2液

水: 日本薬局方精製水

回転数 50 rpm (pH1.2、3.0、6.8) 100rpm (pH6.8)

<判定基準>

pH1.2 50rpm	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 (45 分)、および規定された試験時間 (120 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 $\pm 8\%$ および $\pm 15\%$ の範囲にある。
pH3.0 50rpm	試験製剤は 15 分以内に平均 85% 以上溶出する。
pH6.8 50rpm	標準製剤の平均溶出率が 40% および 85% 付近の適当な 2 時点 (10 分 および 45 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 $\pm 15\%$ の範囲にある。
水 50rpm	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 (60 分)、および規定された試験時間 (360 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 $\pm 8\%$ の範囲にある。
pH6.8 100rpm	標準製剤の平均溶出率が 40% および 85% 付近の適当な 2 時点 (5 分 および 45 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 $\pm 15\%$ の範囲にある。

<結果>

クラリスロマイシン錠 200mg「フェルゼン」の溶出性につき検討を行った結果、平均溶出率は pH1.2・120 分で 80%以上、pH3.0・10 分で 90%以上、pH6.8・45 分で 85%以上、水では 360 分で 30%以下であった。

水における平均溶出率が低かった理由は、製剤特性というより、むしろ本剤の活性成分であるクラリスロマイシンが水に溶けにくいという溶解特性によるものと思われた。

<pH1.2における平均溶出率 (%) >

時間 (分)	5	10	15	30	45	60	90	120
クラリスロマイシン錠 200mg「フェルゼン」	5.0	10.0	14.8	28.0	40.1	50.5	68.7	82.6
標準製剤	6.5	11.6	16.1	29.1	40.9	51.7	69.7	84.2

<pH3.0における平均溶出率 (%) >

時間 (分)	5	10	15	30
クラリスロマイシン錠 200mg「フェルゼン」	79.3	92.7	95.6	96.2
標準製剤	85.1	102.4	101.5	100.1

<pH6.8における平均溶出率 (%) >

時間 (分)	5	10	15	30	45	60	90
クラリスロマイシン錠 200mg「フェルゼン」	24.6	47.1	62.3	80.5	87.8	92.0	97.2
標準製剤	29.7	48.0	57.7	73.9	82.5	88.0	94.7

<水における平均溶出率 (%) >

時間 (分)	5	10	15	30	45	60	90	120	180	240	300	360
クラリスロマイ シン錠 200mg 「フェルゼン」	6.8	10.3	11.7	13.2	14.1	14.8	15.9	17.0	19.3	20.8	23.2	24.7
標準製剤	4.3	7.2	8.8	9.3	9.3	9.7	11.0	11.6	13.8	15.3	17.2	19.0

