

モンテルカスト錠 10mg 「TCK」の生物学的同等性試験
—溶出挙動の類似性—

辰巳化学株式会社

I. 溶出試験

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 24 年 2 月 29 日、薬食審査発 0229 第 10 号）」（以下「同等性試験ガイドライン」という）に基づき、試験製剤モンテルカスト錠 10mg 「TCK」及び標準製剤キプレス®錠 10mg の溶出挙動を比較したので、試験結果を Table 1～5、Fig 1～5 に示す。

II. 結果

pH1.2（毎分 50 回転）の試験条件において、標準製剤の規定された試験時間（120 分）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（30 分）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±9%の範囲にあった。

pH4.0（毎分 50 回転）の試験条件において、規定された試験時間（360 分）における試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

pH6.8（毎分 50 回転）の試験条件において、規定された試験時間（15 分^注）における試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

水（毎分 50 回転）の試験条件において、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（15 分及び 30 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%の範囲にあった。

pH1.2（毎分 100 回転）の試験条件において、標準製剤の規定された試験時間（120 分）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（15 分）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±9%の範囲にあった。

以上の結果より、モンテルカスト錠 10mg 「TCK」は標準製剤の平均溶出率と比較した結果、全ての溶出試験条件において同等性試験ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

注) 『「後発医薬品の生物学的同等性ガイドラインに関する質疑応答集（Q&A）について」等の改正等について（平成 24 年 2 月 29 日、事務連絡）』の Q-42（A）内「溶出した測定対象成分が分解、反応、析出などによって見かけ上減少するような場合には、極大までの推移で溶出挙動を比較する」に従い、極大となる溶出率を示す時間を規定された試験時間とした。

Table 1 pH1.2（毎分 50 回転）における平均溶出率（%）

溶出時間（分）	5	10	15	30	45	60	90	120
試験製剤	3.4	4.9	8.0	14.3	18.4	21.4	25.4	27.8
標準製剤	2.8	5.0	7.2	12.2	15.5	18.0	21.6	24.2

Table 2 pH4.0（毎分 50 回転）における平均溶出率（%）

溶出時間（分）	5	10	15	30	45	60	90	120	180	240	300	360
試験製剤	0.1	0.3	0.6	1.3	1.5	1.7	1.5	0.8	0.4	0.3	0.2	0.2
標準製剤	0.1	0.2	0.2	0.2	0.3	0.3	0.3	0.3	0.4	0.4	0.4	0.4

Table 3 pH6.8（毎分 50 回転）における平均溶出率（%）

溶出時間（分）	5	10	15	30	45	60	90	120	180	240	300	360
試験製剤	6.6	20.4	25.0	22.6	17.6	15.3	10.3	9.0	8.2	7.4	6.1	5.8
標準製剤	4.3	21.8	22.7	19.8	20.8	21.9	18.8	16.9	13.8	11.0	9.8	8.4

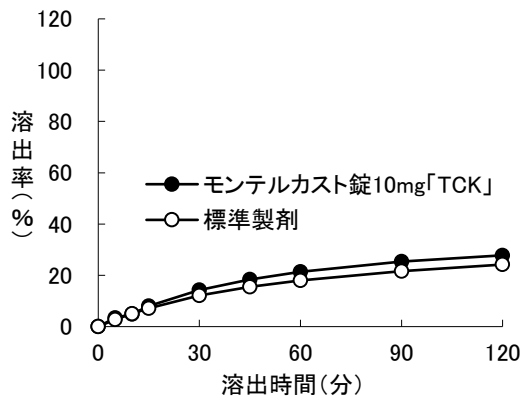
Table 4 水（毎分 50 回転）における平均溶出率（%）

溶出時間（分）	5	10	15	30	45
試験製剤	36.8	69.1	82.1	79.8	62.1
標準製剤	16.5	47.8	71.7	85.0	76.5

Table 5 pH1.2（毎分 100 回転）における平均溶出率（%）

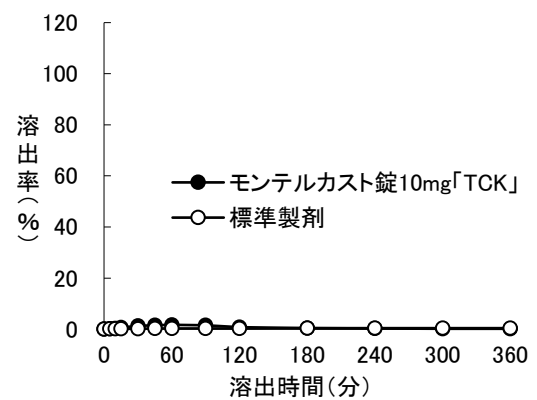
溶出時間（分）	5	10	15	30	45	60	90	120
試験製剤	5.3	11.0	14.8	21.2	25.1	28.0	31.1	32.7
標準製剤	6.3	10.7	14.1	20.4	24.1	27.2	29.9	31.5

Fig 1 pH1.2（毎分 50 回転）



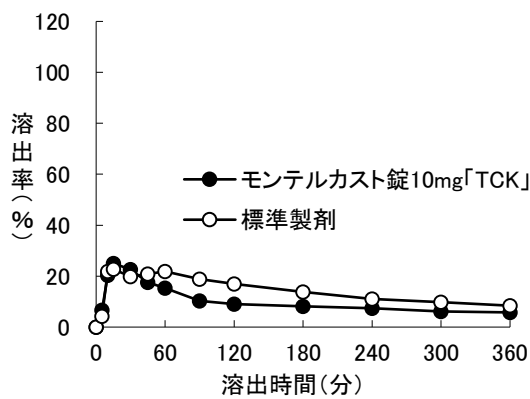
n= 12

Fig 2 pH4.0（毎分 50 回転）



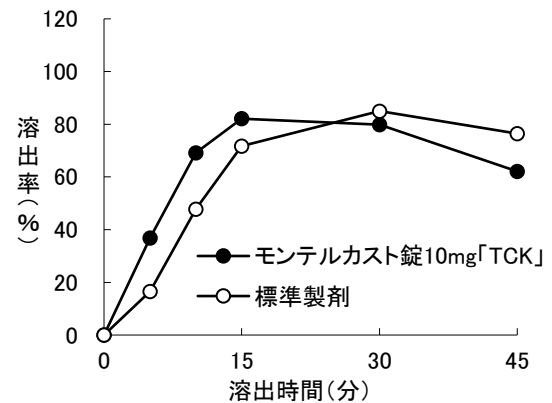
n= 12

Fig 3 pH6.8（毎分 50 回転）



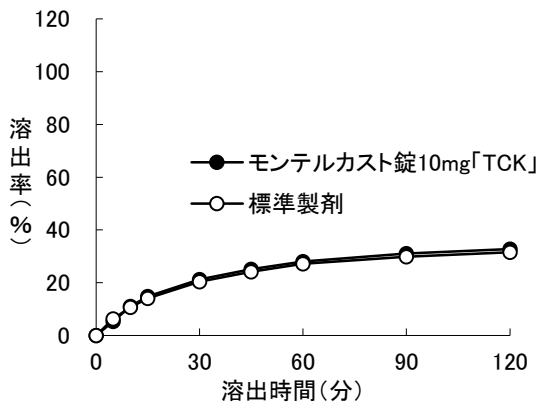
n= 12

Fig 4 水（毎分 50 回転）



n= 12

Fig 5 pH1.2 (毎分 100 回転)



n= 12