

セルトラリン錠 50mg 「三和」
溶出試験

(株) 三和化学研究所

2015.08 作成

1. 試験方法

セルトラリン錠 50mg「三和」（以下、試験製剤）と先発医薬品であるジェイゾロフト錠 50mg（以下、標準製剤）の溶出試験を実施した。

本試験は、平成 24 年 2 月 29 日付薬食審査発 0229 第 10 号厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知「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」における「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の「V. 溶出試験 3. 試験条件 2) 中性又は塩基性薬物を含む製剤、コーティング製剤」に従い実施した。

1. 1. 製剤

表 1 使用製剤一覧

	試験製剤	標準製剤
製品名	セルトラリン錠 50mg「三和」	ジェイゾロフト錠 50mg
含有量	1錠中に塩酸セルトラリン 56mg（セルトラリンとして 50mg）を含有	
剤形	フィルムコーティング錠	フィルムコート錠

1. 2. 試験条件

試験条件の一覧を表 2 に示した。

表 2 試験条件

装置	「日局」一般試験法 溶出試験法のパドル法	
試験液の量	900mL	
試験液の温度	37±0.5℃	
回転数	50rpm	100rpm
試験液	pH1.2 = 「日局」溶出試験第 1 液	pH6.8 = 「日局」溶出試験第 2 液
	pH5.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液	
	pH6.8 = 「日局」溶出試験第 2 液	
	水	

1. 3. 判定基準

全ての溶出試験条件において、以下の基準に適合するとき、溶出挙動が類似していると判定する。

②標準製剤が15～30分に平均85%以上溶出する場合

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%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。

③標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

a. 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%以上となる時、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±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値は42以上である。

2. 試験結果

各試験液での試験結果を表 3～7 及び図 1～5 に示した。

3. 結論

セルトラリン錠 50mg「三和」と標準製剤の平均溶出率を比較したところ、pH1.2、pH5.0、pH6.8 及び水の 50 回転においてはガイドラインの判定基準に適合した。しかし、pH6.8 の 100 回転においてはガイドラインの判定基準に適合せず、両製剤の溶出挙動は類似性が認められなかった。

なお、ヒトでの生物学的同等性試験においては同等の結果が得られている。

表3 試験製剤と標準製剤の溶出試験結果（回転数：50rpm、試験液：pH1.2）

時間	溶出率 (%)	
	試験製剤	標準製剤
5分後	65.9	29.7
10分後	79.4	48.4
15分後	83.6	59.7
30分後	86.7	73.5
45分後	87.8	78.9
60分後	88.3	81.9
90分後	89.5	85.4

<判定基準：③a>

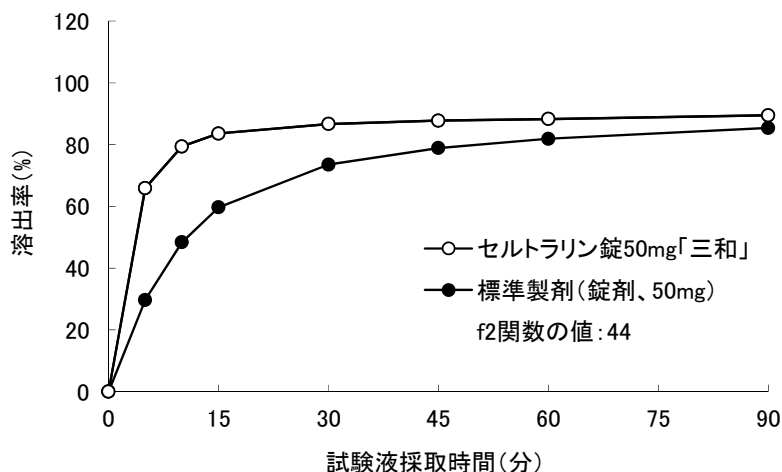


図1 溶出挙動の比較（回転数：50rpm、試験液：pH1.2）

表4 試験製剤と標準製剤の溶出試験結果（回転数：50rpm、試験液：pH5.0）

時間	溶出率 (%)	
	試験製剤	標準製剤
5分後	52.6	20.7
10分後	61.9	31.7
15分後	65.0	39.9
30分後	69.4	56.1
45分後	71.8	66.2
60分後	73.9	72.4
120分後	79.4	83.9
180分後	83.7	88.4

<判定基準：③a>

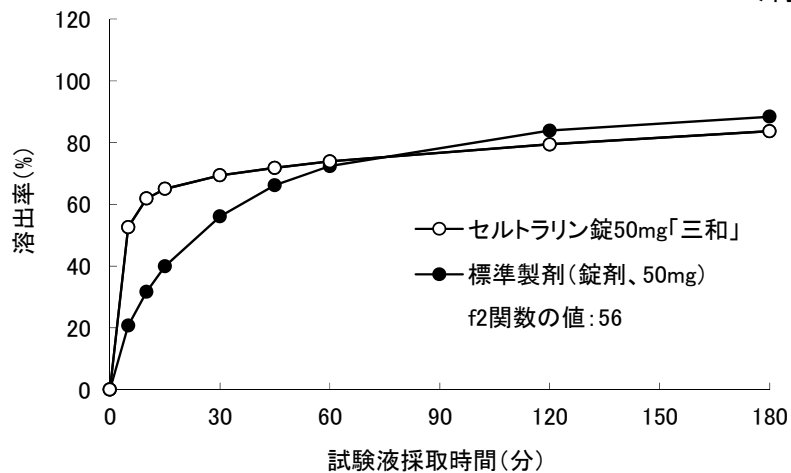


図2 溶出挙動の比較（回転数：50rpm、試験液：pH5.0）

表 5 試験製剤と標準製剤の溶出試験結果（回転数：50rpm、試験液：pH6.8）

時間	溶出率 (%)	
	試験製剤	標準製剤
5 分後	40.3	17.5
10 分後	47.9	26.2
15 分後	51.6	32.1
30 分後	57.7	42.9
45 分後	61.1	49.8
60 分後	62.8	54.7
90 分後	65.0	62.1
120 分後	67.5	67.4
180 分後	70.9	75.3
240 分後	73.0	80.9
300 分後	75.0	85.1
360 分後	76.7	88.0

<判定基準：③a>

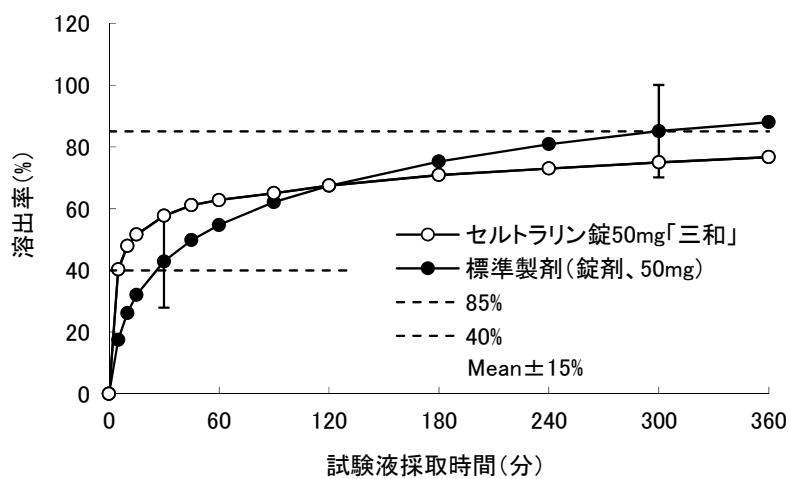


図 3 溶出挙動の比較（回転数：50rpm、試験液：pH6.8）

表 6 試験製剤と標準製剤の溶出試験結果（回転数：50rpm、試験液：水）

時間	溶出率 (%)	
	試験製剤	標準製剤
5 分後	60.3	39.1
10 分後	68.5	50.0
15 分後	73.0	55.3
30 分後	78.8	62.7
45 分後	81.8	67.1
60 分後	83.6	71.2
120 分後	88.6	80.4
180 分後	91.4	86.3
240 分後	93.7	90.0
300 分後	94.9	92.4

<判定基準：③a>

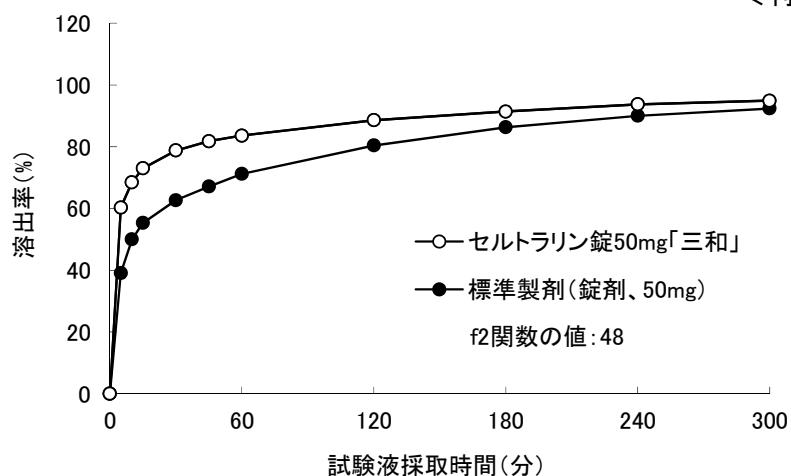


図 4 溶出挙動の比較（回転数：50rpm、試験液：水）

表 7 試験製剤と標準製剤の溶出試験結果（回転数：100rpm、試験液：pH6.8）

時間	溶出率 (%)	
	試験製剤	標準製剤
5 分後	85.6	42.7
10 分後	95.5	58.6
15 分後	98.1	68.8
30 分後	98.8	85.7
45 分後	99.2	92.9
60 分後	99.1	97.0

<判定基準：②>

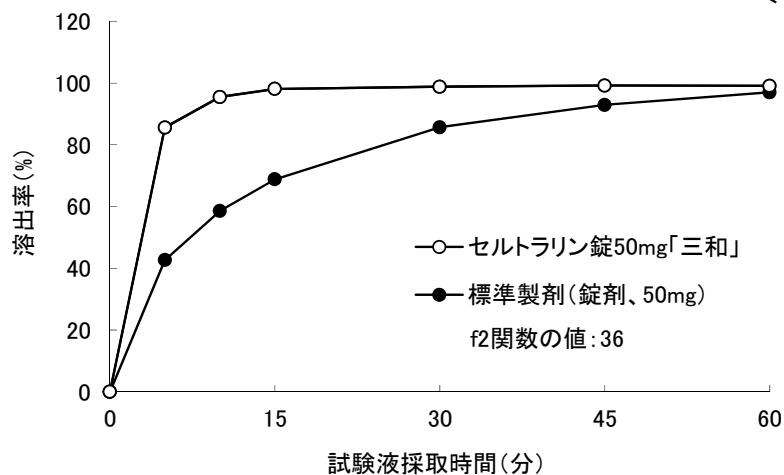


図 5 溶出挙動の比較（回転数：100rpm、試験液：pH6.8）