

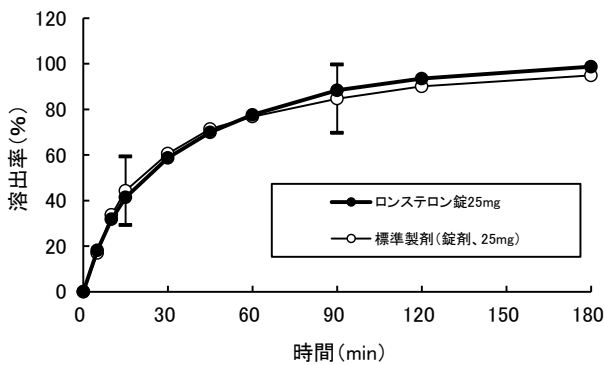
ロステロン錠 25mg の溶出試験に関する資料

日新製薬株式会社

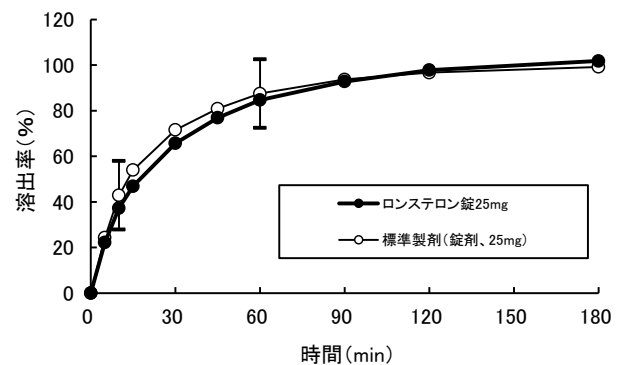
1. 溶出試験

ロステロン錠 25mg（日新製薬）及び標準製剤（錠剤、クロルマジノン酢酸エステルとして 25mg）について、日本薬局方溶出試験法第 2 法により、4 種試験液（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水、いずれも 0.4%ラウリル硫酸ナトリウム添加）、50rpm における溶出試験を実施した。

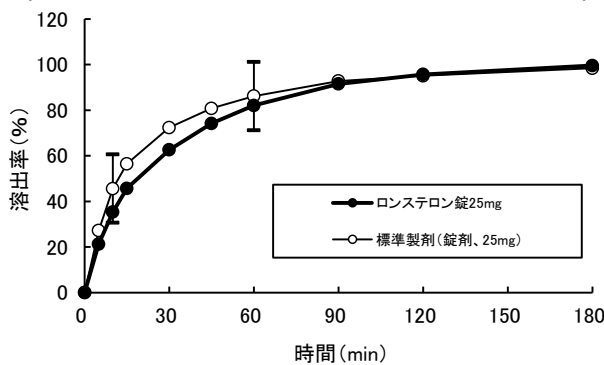
【 pH1.2 [0.4%ラウリル硫酸ナトリウム添加] 50rpm 】



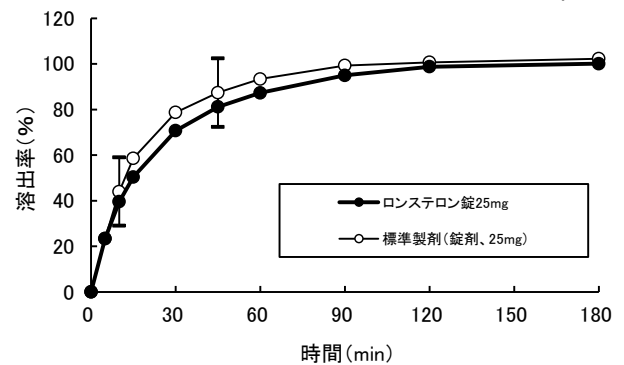
【 pH4.0 [0.4%ラウリル硫酸ナトリウム添加] 50rpm 】




【 pH6.8 [0.4%ラウリル硫酸ナトリウム添加] 50rpm 】



【 水 [0.4%ラウリル硫酸ナトリウム添加] 50rpm 】



回転数	試験液	平均溶出率の判定
パドル法 50rpm	pH1.2 [0.4%ラウリル硫酸ナトリウム添加]	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
	pH4.0 [0.4%ラウリル硫酸ナトリウム添加]	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
	pH6.8 [0.4%ラウリル硫酸ナトリウム添加]	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
	水 [0.4%ラウリル硫酸ナトリウム添加]	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。

※判定ポイントにおける標準製剤の平均溶出率の±15%の範囲を  で示す。

2. まとめ

溶出試験の結果、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 4. 溶出挙動の同等性の判定」に従い判定するとき、ロステロン錠 25mg と標準製剤の溶出挙動は同等であると判定された。

また、ロステロン錠 25mg は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたクロルマジノン酢酸エステル 25mg 錠の溶出規格（ラウリル硫酸ナトリウム溶液（1→250）、50rpm：90 分、75%以上）に適合していることが確認された。

ロステロン錠 25mg の生物学的同等性に関する資料

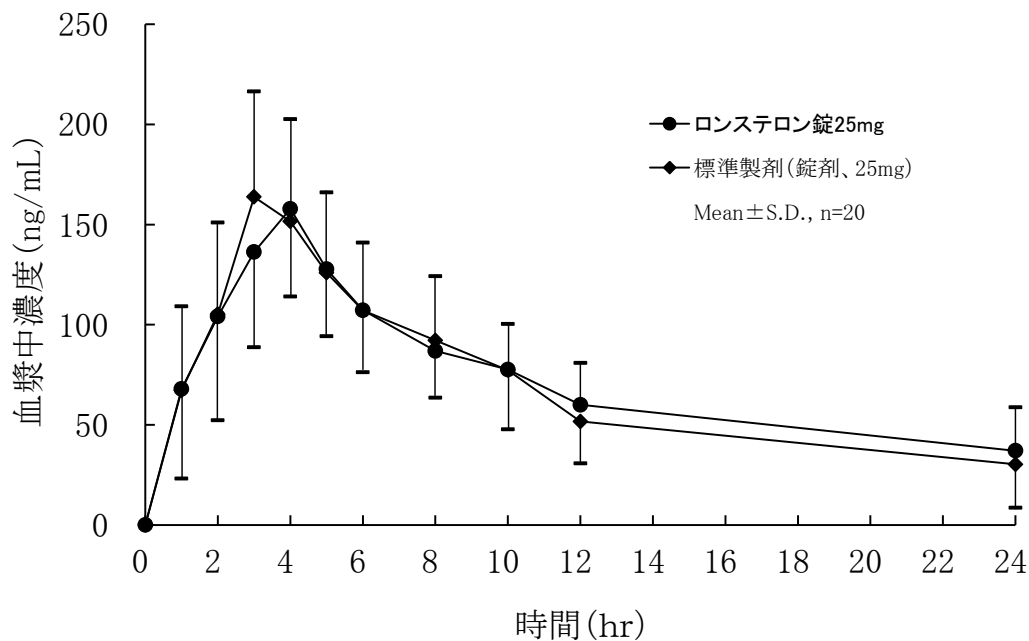
日新製薬株式会社

1. 血漿中濃度比較試験

白色雄性家兔 20 羽に、ロステロン錠 25mg（日新製薬）及び標準製剤（錠剤、クロルマジノン酢酸エステルとして 25mg）を、それぞれ 4 錠（クロルマジノン酢酸エステルとして 100mg）絶食時単回経口投与し、1 カ月間の休薬期間をおいた 2 剤 2 期クロスオーバー法で両製剤の血漿中濃度を比較検討した。

その結果、クロルマジノン酢酸エステルの血漿中未変化体濃度推移は以下に示したとおりで、最高血漿中濃度到達時間 T_{max} はロステロン錠 25mg、標準製剤ともに 3.5 時間、最高血漿中濃度 C_{max} はそれぞれ 175.6ng/mL、179.7ng/mL と算出された。

得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）について統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。



薬剤名	血漿中濃度 (ng/mL)												AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)
	0 hr	1 hr	2 hr	3 hr	4 hr	5 hr	6 hr	8 hr	10 hr	12 hr	24 hr				
ロステロン錠25mg	0.0	67.9	104.1	136.3	157.9	127.7	107.2	86.9	77.6	60.0	37.1	1726.5	175.6	3.5	
±S.D.	-	41.3	51.8	47.6	44.7	38.3	33.8	23.4	22.7	20.9	21.7	466.8	47.9	0.7	
標準製剤(錠剤、25mg)	0.0	67.2	105.3	163.8	151.6	125.9	107.1	92.2	77.3	51.7	30.3	1656.2	179.7	3.5	
±S.D.	-	44.0	45.7	52.6	37.6	31.7	30.8	32.0	29.6	20.9	21.7	440.5	48.1	0.6	

(n=20)

2. まとめ

ロステロン錠 25mg と標準製剤（錠剤、25mg）は生物学的に同等であり、臨床の場においても同等の効果が期待できると判断した。