プソフェキ配合錠「サワイ」

【先発医薬品との比較】

<table>
<tr><td>目的</td><td colspan="3">試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験における溶出挙動の類似性及び同等性の判定を行うため、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年２月29日 薬食審査発0229第10号)に準じ、溶出試験を実施する。</td></tr>
<tr><td>方法</td><td colspan="3">日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法及び回転バスケット法</td></tr>
<tr><td rowspan="5">条件</td><td rowspan="2">回転数・試験液</td><td>フェキソフェナジン塩酸塩</td><td>パドル法
50rpm：pH1.2、50rpm：pH4.0、50rpm：pH6.8、50rpm：水、100rpm：pH1.2</td></tr>
<tr><td>塩酸プソイドエフェドリン</td><td>パドル法
50rpm：pH1.2、50rpm：pH4.0、50rpm：pH6.8、50rpm：水、50rpm：pH6.8(ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加)、100rpm：pH6.8、200rpm：pH6.8
回転バスケット法
100rpm：pH6.8、200rpm：pH6.8</td></tr>
<tr><td>試験液量</td><td colspan="2">900mL</td></tr>
<tr><td>液温度</td><td colspan="2">37±0.5℃</td></tr>
<tr><td>試験数</td><td colspan="2">12ベッセル</td></tr>
<tr><td rowspan="2">検体</td><td>試験製剤</td><td colspan="2">プソフェキ配合錠「サワイ」(ロット番号：753T1S4306、処方変更前)</td></tr>
<tr><td>標準製剤</td><td colspan="2">ディレグラ配合錠(ロット番号：6M132A)</td></tr>
<tr><td>結果</td><td colspan="3">フェキソフェナジン塩酸塩

<50rpm：pH1.2>
標準製剤が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時点(15分)及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±12%の範囲にあった。

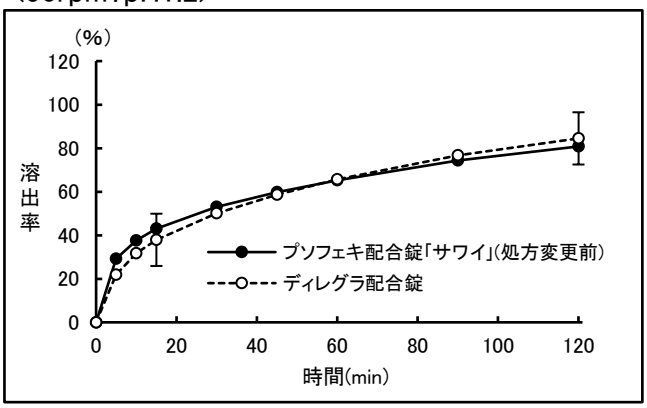
<50rpm：pH4.0>
標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(60分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

<50rpm：pH6.8>
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。
<50rpm：水>
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。
<100rpm：pH1.2>
比較時点(15分)及び標準製剤の平均溶出率が85%付近の適当な時点(60分)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%の範囲にあった。</td></tr>
<tr><td>結論</td><td colspan="3">以上の結果より、フェキソフェナジン塩酸塩について、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</td></tr>
</table>

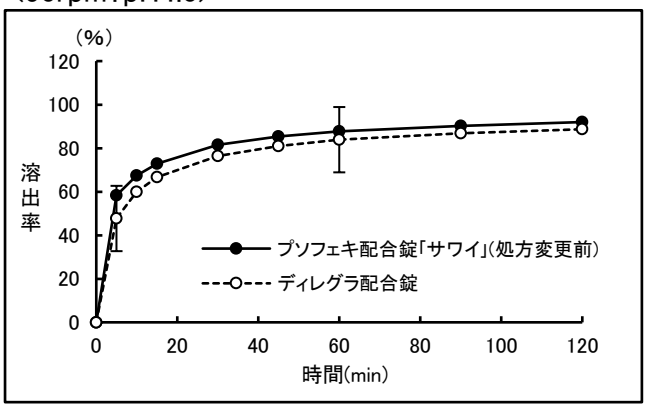
結果	**塩酸プソイドエフェドリン** **パドル法** 〈50rpm：pH1.2〉 標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(30分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±８%の範囲にあった。 〈50rpm：pH4.0〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(420分)付近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈50rpm：pH6.8〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(420分)付近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈50rpm：水〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(360分)付近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈50rpm：pH6.8(ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加)〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(540分)付近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈100rpm：pH6.8〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(420分)付近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈200rpm：pH6.8〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(420分)付近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 **回転バスケット法** 〈100rpm：pH6.8〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(420分)付近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈200rpm：pH6.8〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(420分)付近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。
結論	以上の結果より、塩酸プソイドエフェドリンについて、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

フェキソフェナジン塩酸塩

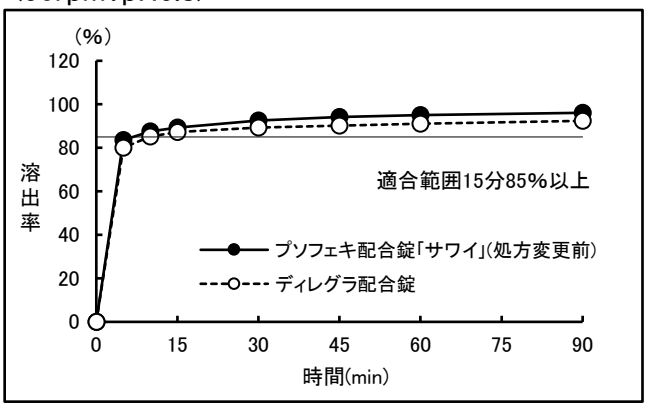
<50rpm：pH1.2>



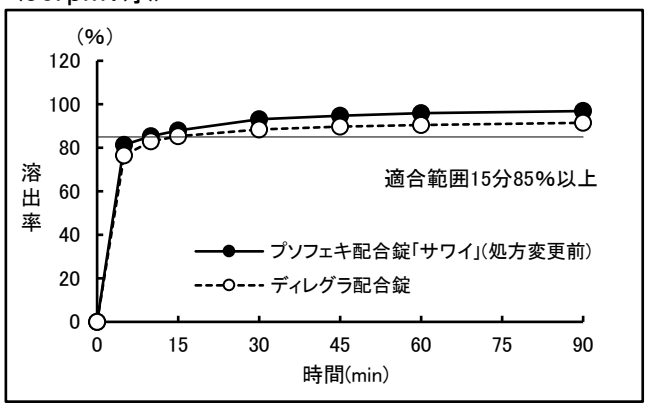
<50rpm：pH4.0>



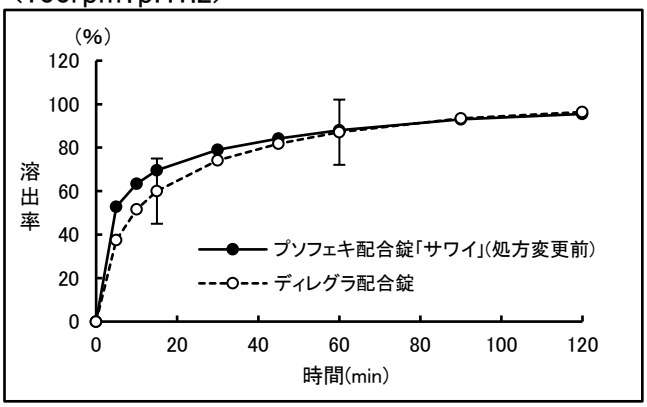
<50rpm：pH6.8>



<50rpm：水>



<100rpm：pH1.2>

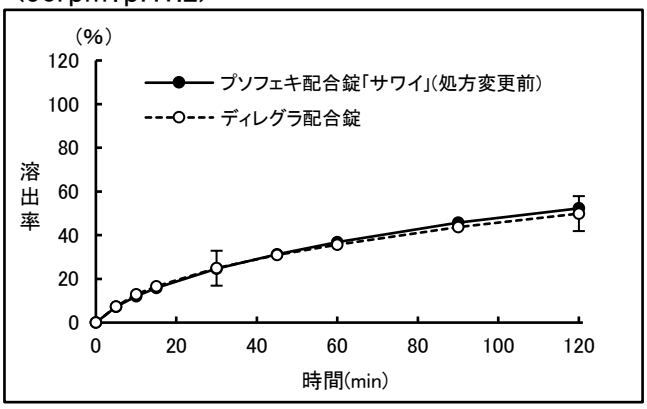


(I：判定基準の適合範囲)

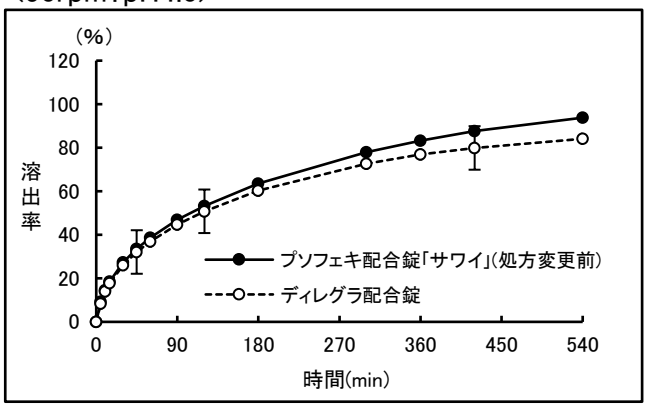
塩酸プソイドエフェドリン

パドル法

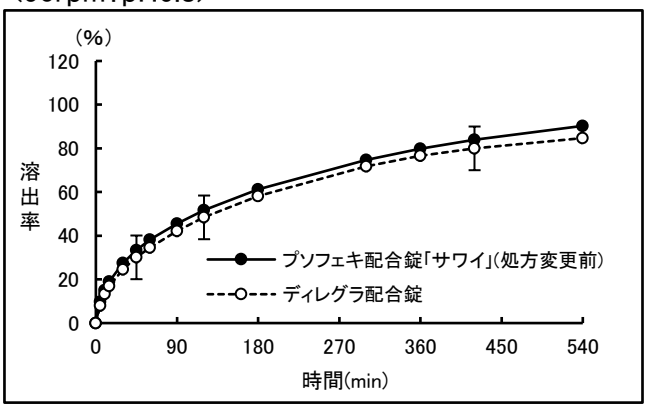
<50rpm：pH1.2>



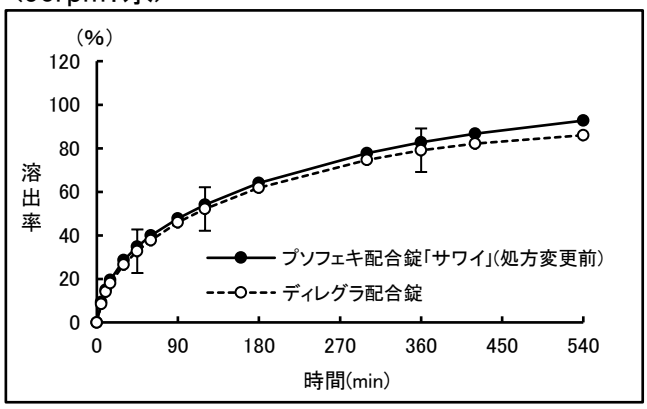
<50rpm：pH4.0>



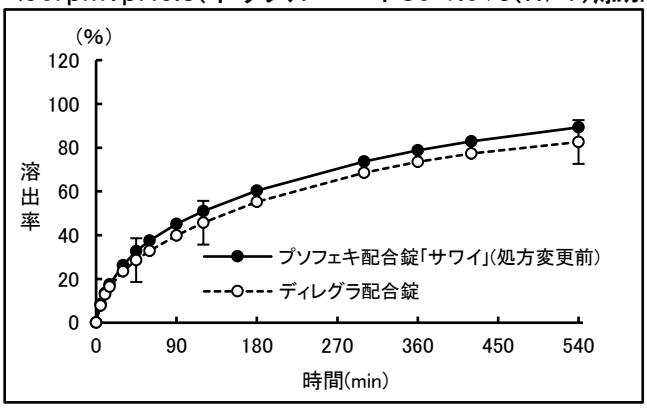
<50rpm：pH6.8>



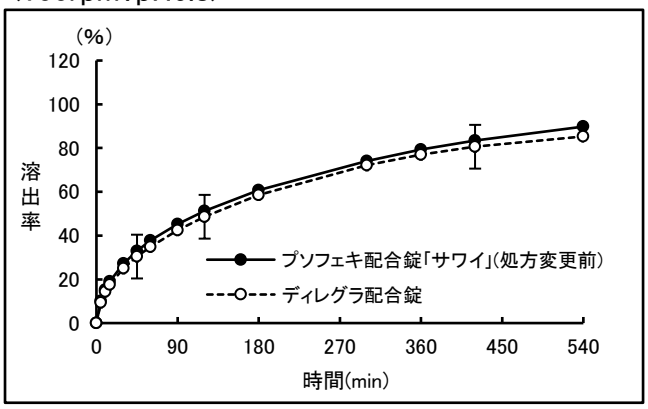
<50rpm：水>



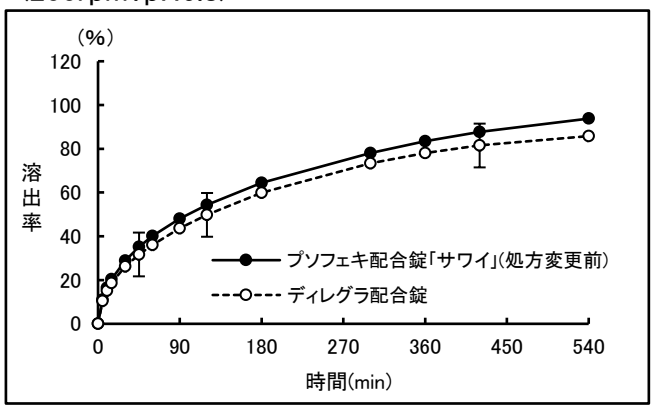
<50rpm：pH6.8(ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加)>



<100rpm：pH6.8>



<200rpm：pH6.8>

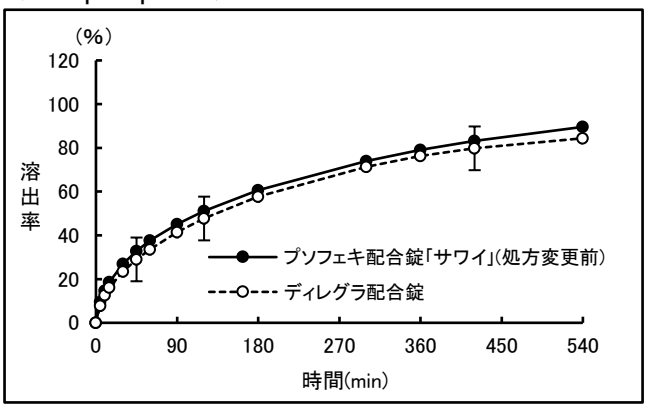


(I：判定基準の適合範囲)

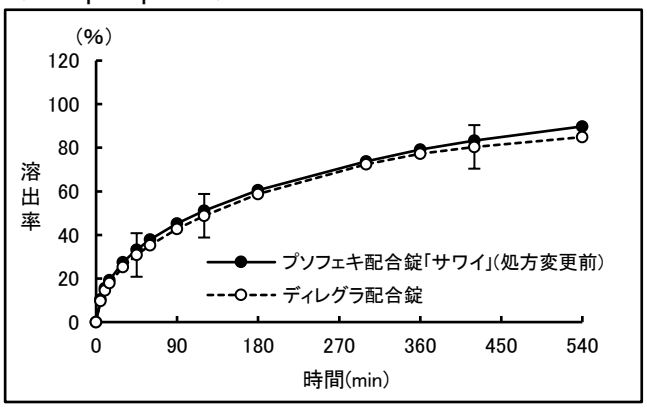
塩酸プソイドエフェドリン

回転バスケット法

<100rpm：pH6.8>



<200rpm：pH6.8>



(I：判定基準の適合範囲)

【処方変更前後の比較】

<table>
<tr><td>目的</td><td colspan="3">処方変更前後の生物学的同等性試験における溶出挙動の類似性及び同等性の判定を行うため、「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号)に準じ、溶出試験を実施する。</td></tr>
<tr><td>方法</td><td colspan="3">日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法及び回転バスケット法</td></tr>
<tr><td rowspan="5">条件</td><td rowspan="2">回転数・試験液</td><td>フェキソフェナジン塩酸塩</td><td>パドル法
50rpm：pH1.2、50rpm：pH4.0、50rpm：pH6.8、50rpm：水、100rpm：pH1.2</td></tr>
<tr><td>塩酸プソイドエフェドリン</td><td>パドル法
50rpm：pH1.2、50rpm：pH5.0、50rpm：pH7.5、50rpm：水、50rpm：pH7.5(ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加)、100rpm：pH7.5、200rpm：pH7.5
回転バスケット法
100rpm：pH7.5、200rpm：pH7.5</td></tr>
<tr><td>試験液量</td><td colspan="2">900mL</td></tr>
<tr><td>液温度</td><td colspan="2">37±0.5℃</td></tr>
<tr><td>試験数</td><td colspan="2">12ベッセル</td></tr>
<tr><td rowspan="2">検体</td><td>試験製剤</td><td colspan="2">プソフェキ配合錠「サワイ」(ロット番号：399TF0201、処方変更後)</td></tr>
<tr><td>標準製剤</td><td colspan="2">プソフェキ配合錠「サワイ」(ロット番号：121245、処方変更前)</td></tr>
<tr><td>結果</td><td colspan="3">フェキソフェナジン塩酸塩

〈50rpm：pH1.2〉
標準製剤の平均溶出率が40%(10分)及び85%(120分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲になかったが、f2関数の値が42以上であった。

〈50rpm：pH4.0〉
標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(60分)付近の2時点において、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。

〈50rpm：pH6.8〉
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

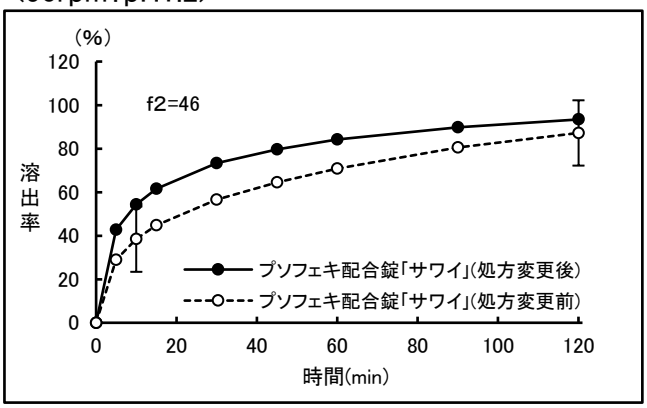
〈50rpm：水〉
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

〈100rpm：pH1.2〉
標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(60分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲になかったが、f2関数の値が42以上であった。</td></tr>
<tr><td>結論</td><td colspan="3">以上の結果より、フェキソフェナジン塩酸塩について、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</td></tr>
</table>

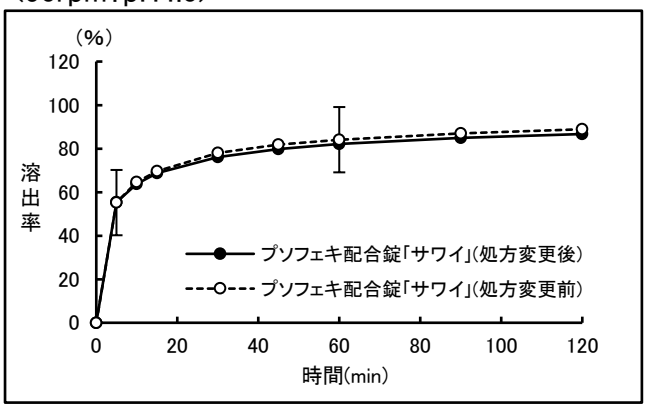
結果	**塩酸プソイドエフェドリン** **パドル法** 〈50rpm：pH1.2〉 標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(30分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±８%の範囲にあった。 〈50rpm：pH5.0〉 標準製剤の平均溶出率が30%(30分)、50%(90分)及び80%(300分)付近の３時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈50rpm：pH7.5〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(360分)付近の３時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈50rpm：水〉 標準製剤の平均溶出率が30%(30分)、50%(90分)及び80%(300分)付近の３時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈50rpm：pH7.5(ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加)〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(360分)付近の３時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈100rpm：pH7.5〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(360分)付近の３時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈200rpm：pH7.5〉 標準製剤の平均溶出率が30%(30分)、50%(90分)及び80%(300分)付近の３時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 **回転バスケット法** 〈100rpm：pH7.5〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(360分)付近の３時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。 〈200rpm：pH7.5〉 標準製剤の平均溶出率が30%(45分)、50%(120分)及び80%(360分)付近の３時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。
結論	以上の結果より、塩酸プソイドエフェドリンについて、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

フェキソフェナジン塩酸塩

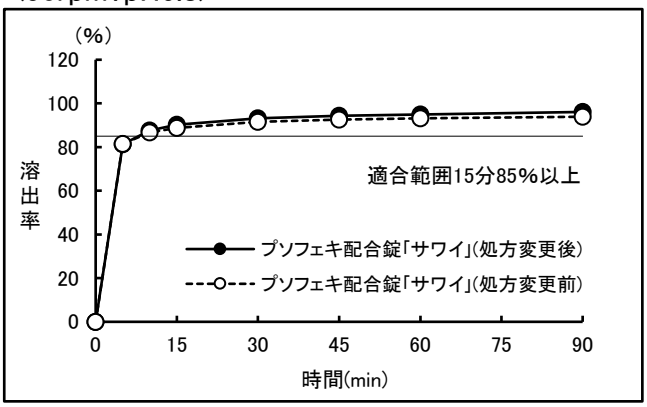
〈50rpm：pH1.2〉



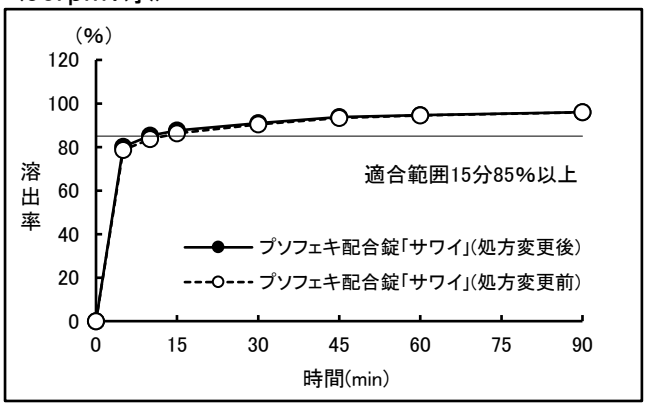
〈50rpm：pH4.0〉



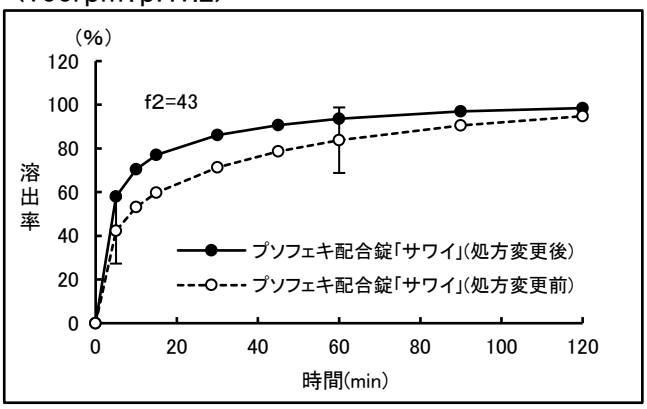
〈50rpm：pH6.8〉



〈50rpm：水〉



〈100rpm：pH1.2〉

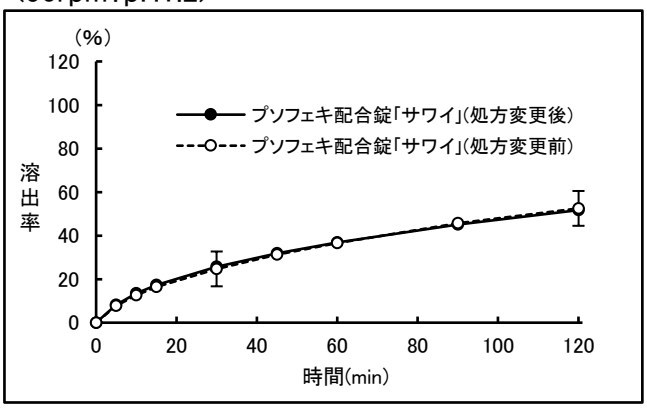


(I：判定基準の適合範囲)

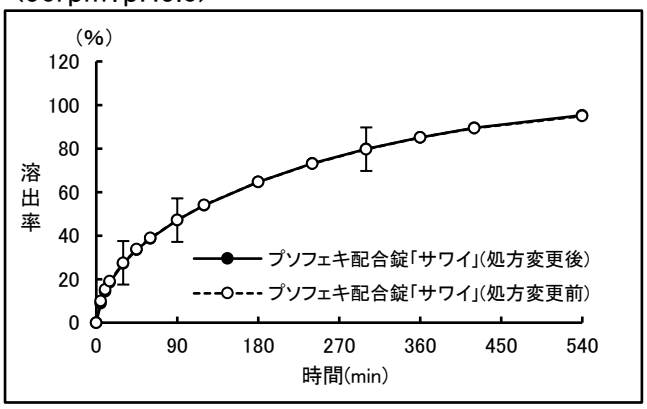
塩酸プソイドエフェドリン

パドル法

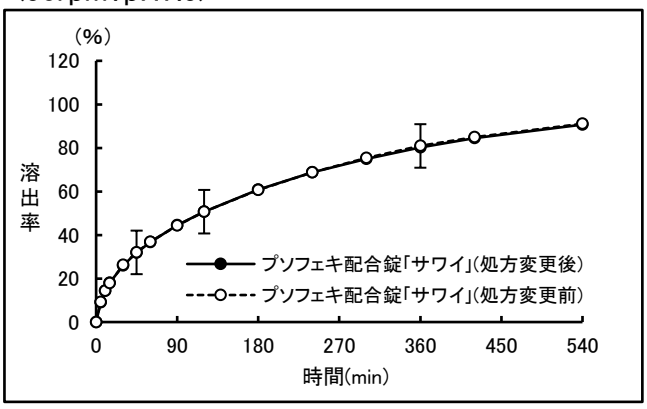
<50rpm：pH1.2>



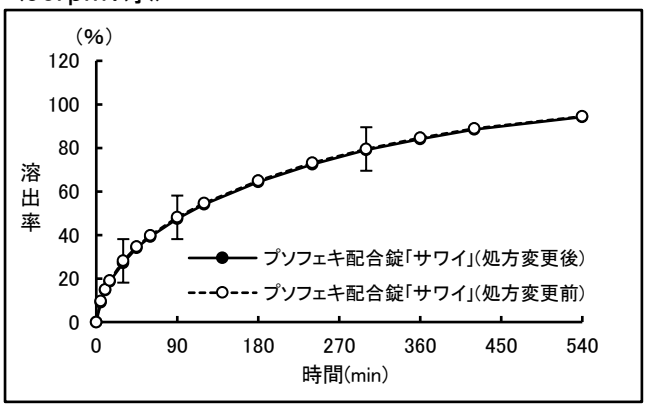
<50rpm：pH5.0>



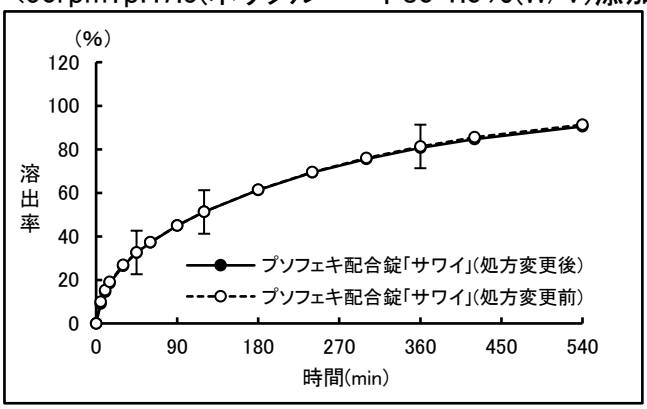
<50rpm：pH7.5>



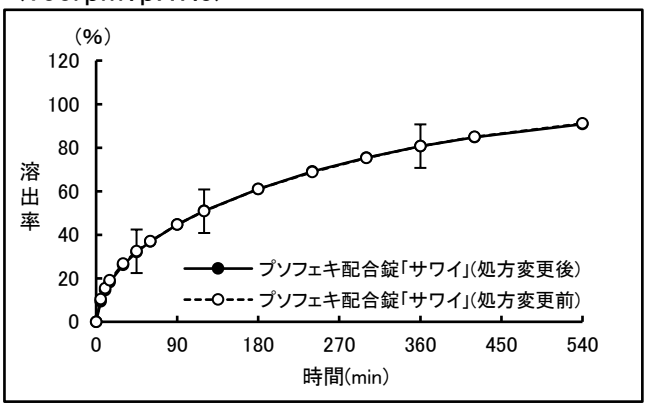
<50rpm：水>



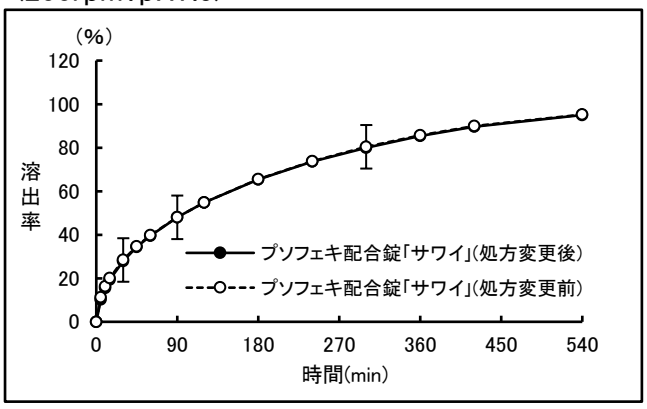
<50rpm：pH7.5(ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加)>



<100rpm：pH7.5>



<200rpm：pH7.5>

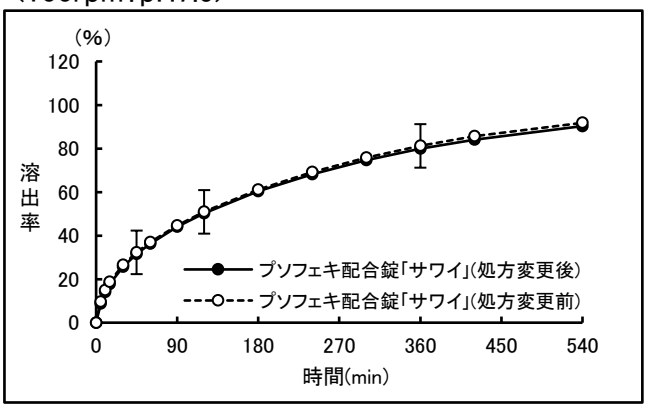


(I：判定基準の適合範囲)

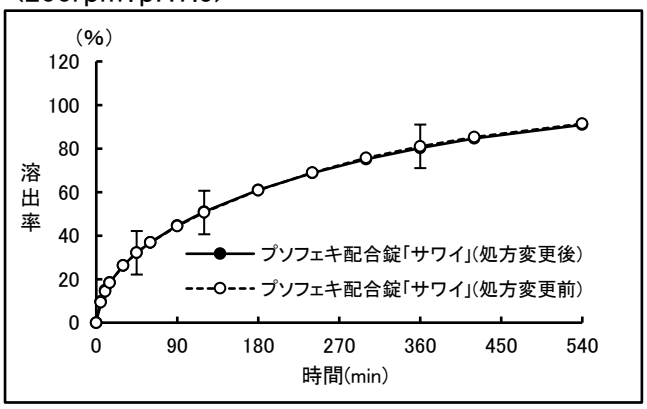
塩酸プソイドエフェドリン

回転バスケット法

<100rpm：pH7.5>



<200rpm：pH7.5>



(I：判定基準の適合範囲)

沢井製薬(株) 申請資料：プソフェキ配合錠「サワイ」 溶出試験より作成