

エゼロス配合錠LD「サワイ」

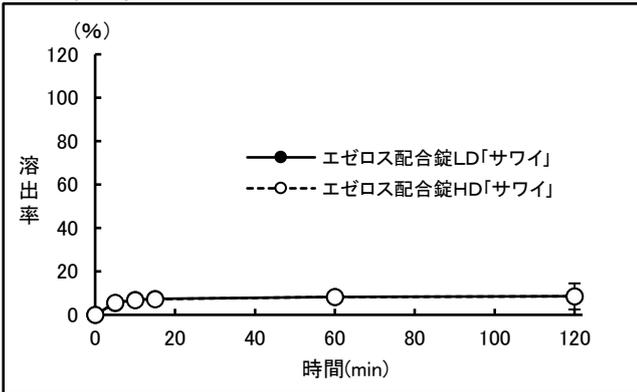
目的	試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験における溶出挙動の同等性の判定及び生物学的同等性の確認を行うため、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日薬生薬審発0319第1号)に準じ、溶出試験を実施する。		
方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 回転バスケット法及びパドル法		
条件	回転数・試験液	エゼチミブ	回転バスケット法 100rpm:pH1.2、100rpm:pH4.0、100rpm:pH6.8、100rpm:水、 100rpm:pH1.2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加、 100rpm:pH4.0ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加、 100rpm:pH6.8ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加
			パドル法 100rpm:pH1.2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加
		ロスバスタチン カルシウム	回転バスケット法 100rpm:pH1.2、100rpm:pH5.0、100rpm:pH6.8、100rpm:水
			パドル法 100rpm:pH5.0
	試験液量	900mL	
液温度	37±0.5℃		
試験数	12ベッセル		
検体	試験製剤	エゼロス配合錠LD「サワイ」(ロット番号:810T1S1646)	
	標準製剤	エゼロス配合錠HD「サワイ」(ロット番号:810T2S1645)	
結果	エゼチミブ 回転バスケット法 <100rpm:pH1.2> 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±6%の範囲にあった。 最終比較時点(120分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。 <100rpm:pH4.0> 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±6%の範囲にあった。 最終比較時点(360分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。 <100rpm:pH6.8> 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±6%の範囲にあった。 最終比較時点(360分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。 <100rpm:水> 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±6%の範囲にあった。 最終比較時点(360分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。		

	<p><100rpm: pH1.2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加> 標準製剤の平均溶出率が40%(15分[※])及び85%(30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±10%の範囲にあった。 最終比較時点(30分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p><100rpm: pH4.0ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加> 標準製剤の平均溶出率が60%(15分[※])及び85%(20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±10%の範囲にあった。 最終比較時点(20分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p><100rpm: pH6.8ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加> 標準製剤の平均溶出率が60%(15分[※])及び85%(20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±10%の範囲にあった。 最終比較時点(20分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>パドル法 <100rpm: pH1.2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加> 標準製剤の平均溶出率が60%(15分[※])及び85%(30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±10%の範囲にあった。 最終比較時点(30分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p>
結果	<p>ロスバスタチンカルシウム 回転バスケット法 <100rpm: pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p><100rpm: pH5.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p><100rpm: pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p><100rpm: 水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>パドル法 <100rpm: pH5.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p>
結論	<p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。 本剤の処方変更水準はB水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。</p>

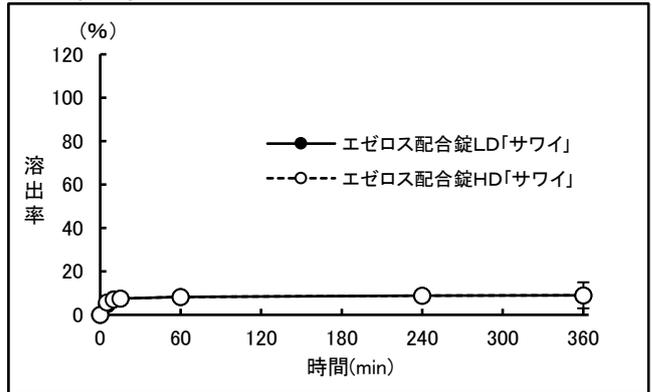
※: 比較時点が15分未満となったため、比較時点を15分として溶出挙動の評価を行った。

エゼチミブ
回転バスケット法

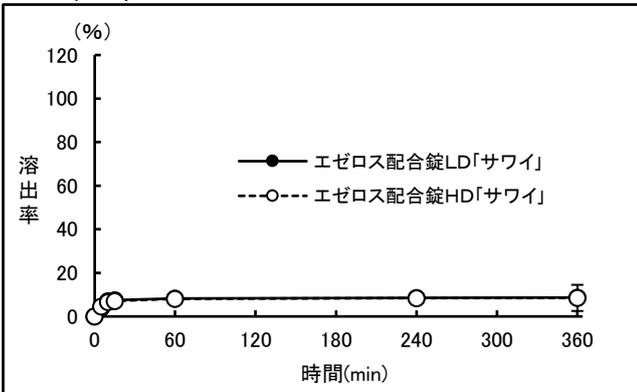
<100rpm: pH1.2>



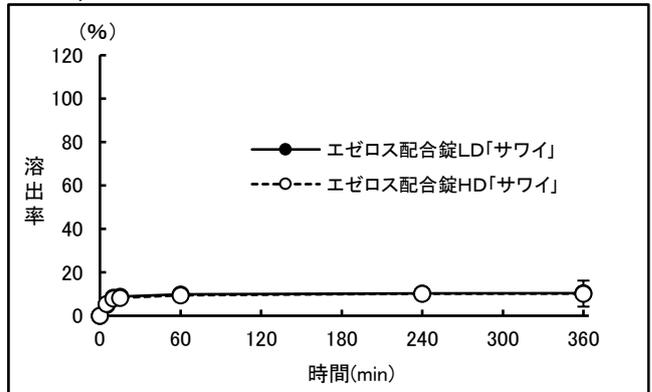
<100rpm: pH4.0>



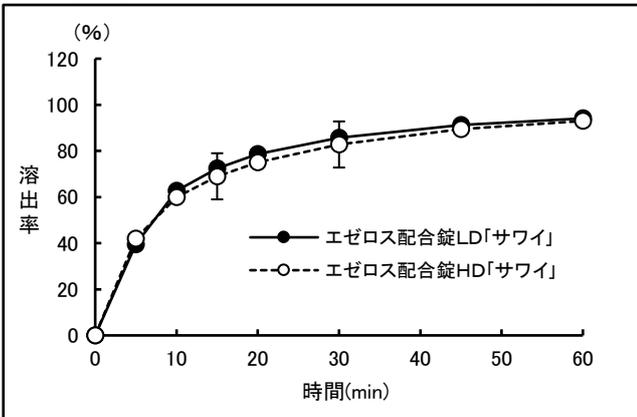
<100rpm: pH6.8>



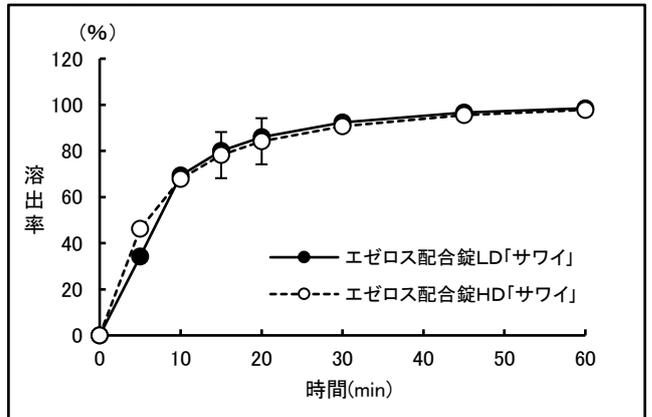
<100rpm: 水>



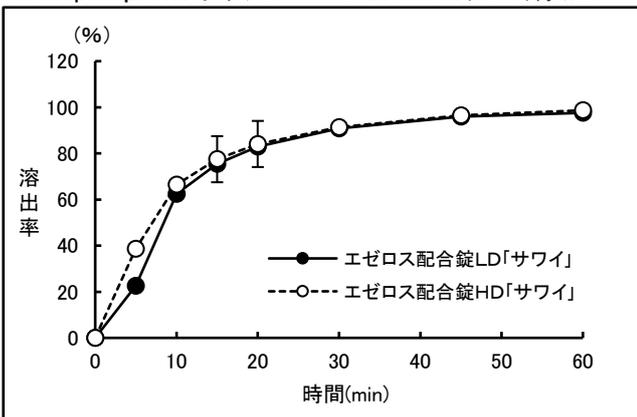
<100rpm: pH1.2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



<100rpm: pH4.0ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



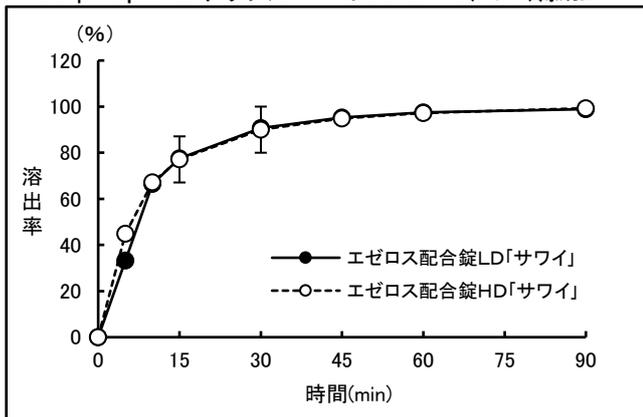
<100rpm: pH6.8ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



(): 判定基準の適合範囲

パドル法

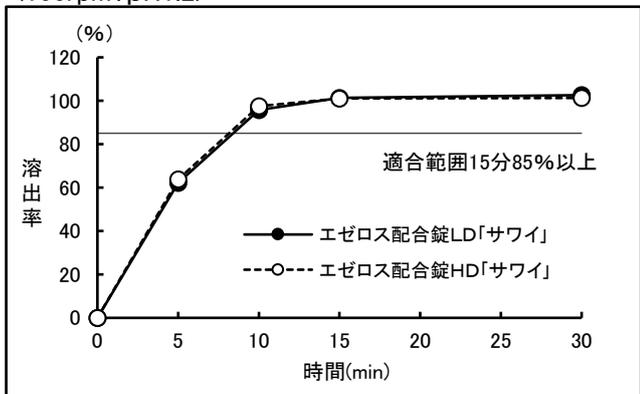
<100rpm: pH1.2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



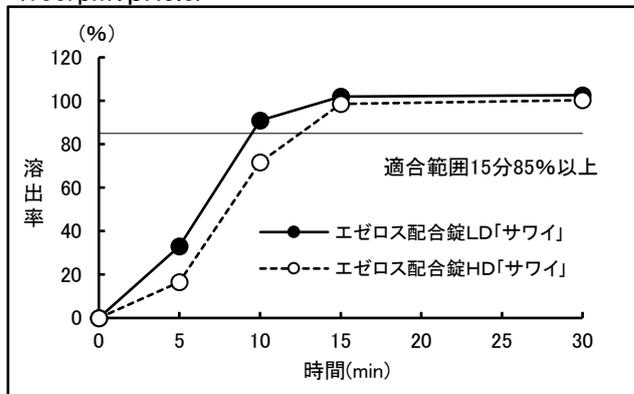
ロスバスタチンカルシウム

回転バスケット法

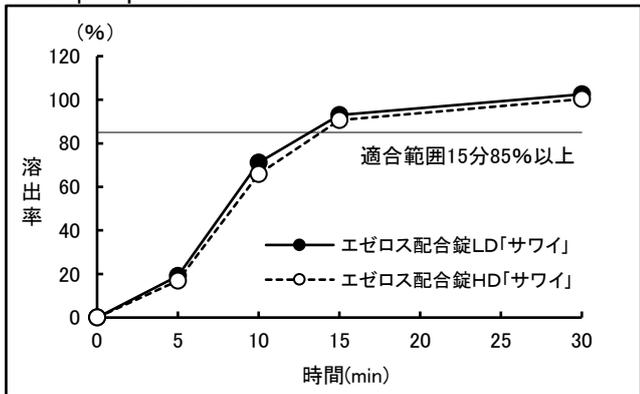
<100rpm: pH1.2>



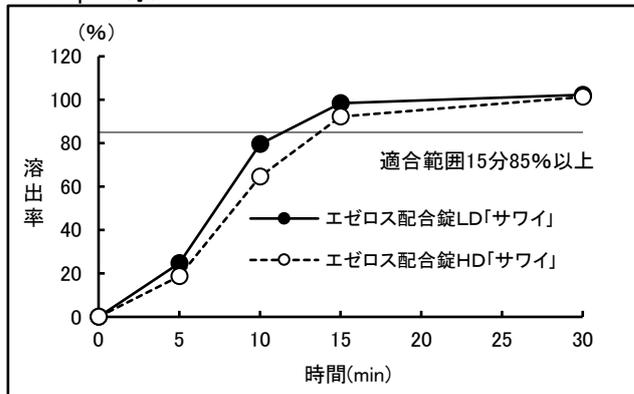
<100rpm: pH5.0>



<100rpm: pH6.8>



<100rpm: 水>



パドル法

<100rpm: pH5.0>

