

セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」の生物学的同等性資料

岩城製薬 学術部

	銘柄名	販売会社
試験製剤	セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」	岩城製薬
標準製剤	ジルテック錠 10	第一三共製薬

(1) 後発医薬品ガイドラインにおける製剤の溶出試験

セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」と標準製剤について pH1.2、5.0、6.8 及び水の 4 条件について後発医薬品ガイドラインにおける溶出試験を行い、その溶出パターンを比較した。

溶出方法：日局溶出試験法第2法（パドル法）

攪拌速度：50rpm、pH1.2において100rpm

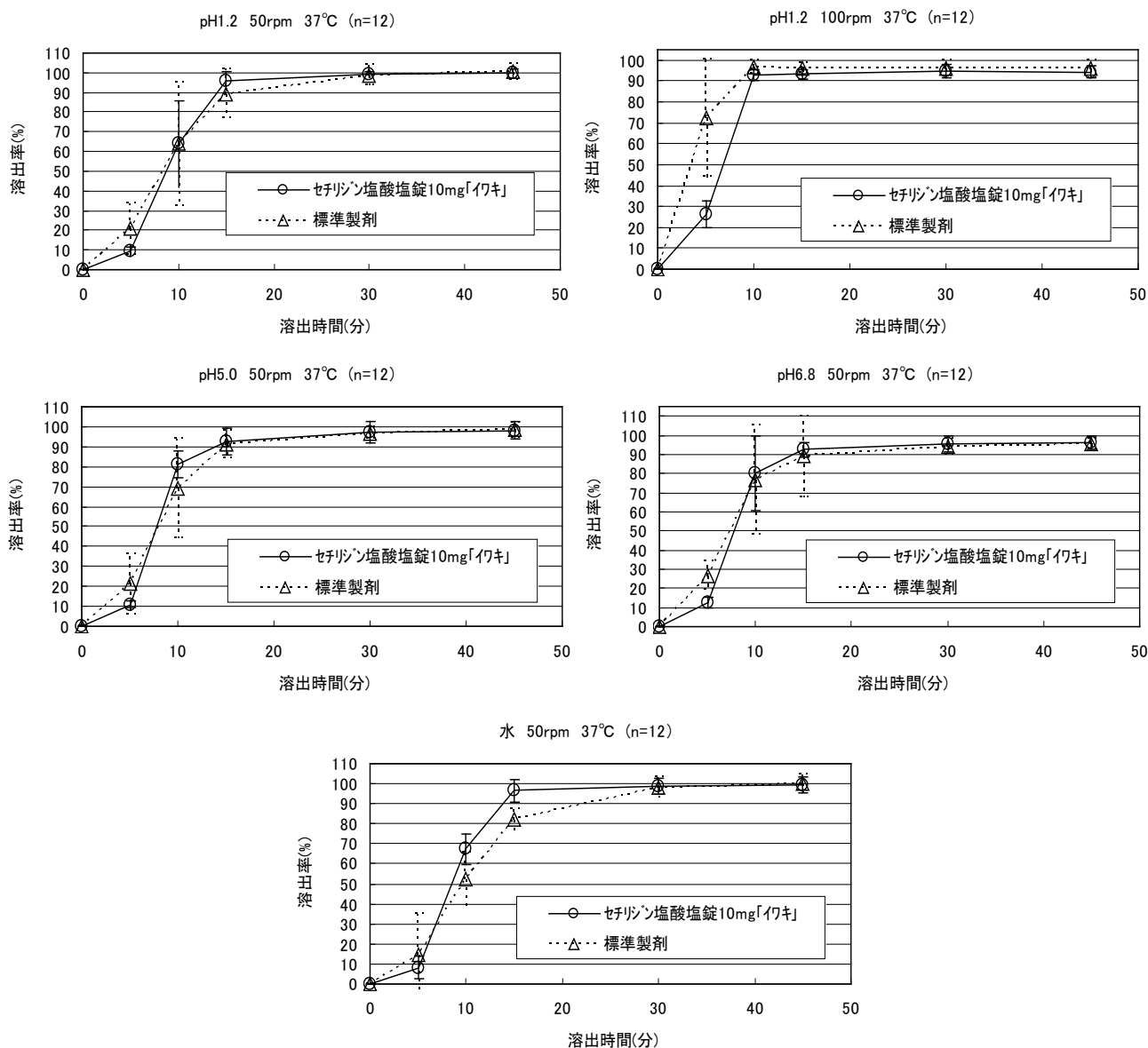
溶出液： pH1.2（日局崩壊試験の第1液）

pH5.0（McIlvaineの緩衝液）

pH6.8（日局崩壊試験の第2液）

水

結果：

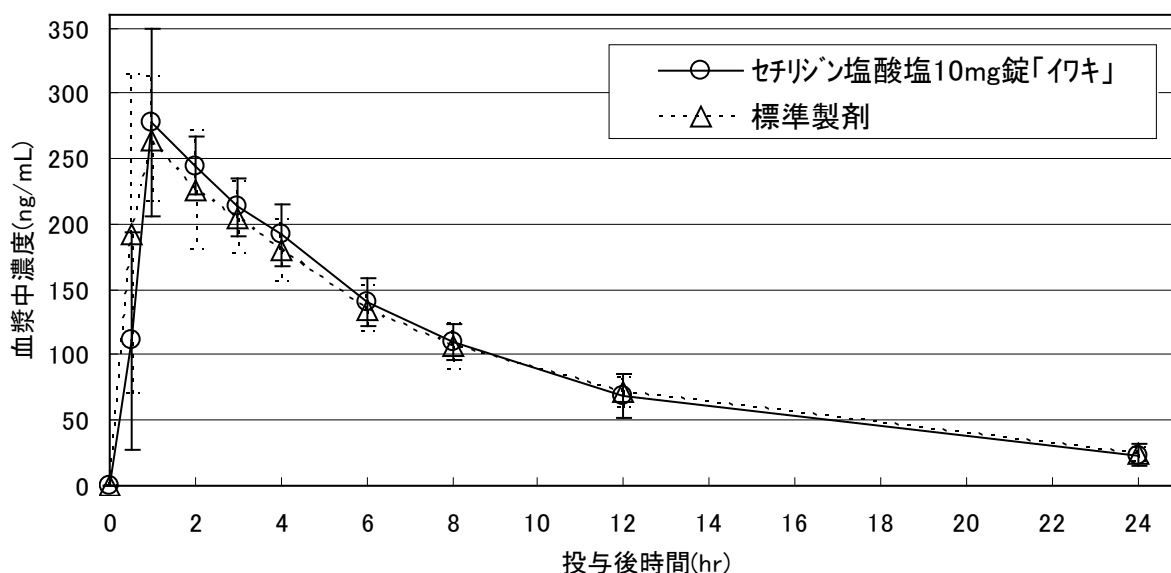


考 察：試験液 pH1.2、pH5.0、pH6.8 及び水において標準製剤およびセチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」ともに 15 分以内に 85%以上が溶出した。
 後発医薬品のガイドラインにおける溶出挙動の類似性を判定する時、水では標準製剤が 15 分～30 分に平均 85%溶出しており、ガイドラインに従って求めた f2 関数の値は 53.4 であり、ガイドラインに定めるところの 45 以上であった。以上から、セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」の pH1.2、pH5.0、pH6.8 及び水における溶出挙動に標準製剤との類似性を認めた。

(2)後発医薬品ガイドラインにおける生物学的同等性試験（血漿中薬物濃度）

セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（セチリジン塩酸塩として 10mg）健康成人男子 20 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。
 なお、被験者には期間中に自覚症状、他覚所見、生理学的検査及び臨床検査について有害事象は認められず、安全性に問題はなかった。

セチリジン血漿中濃度(n=20)



薬物動態パラメータ（平均値±標準偏差、n=20）

パラメータ	T _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-24hr} (ng・hr/mL)
セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」	1.2±0.4	296.9±39.3	6.5±0.9	2306.7±288.1
標準製剤（錠剤、10mg）	1.0±0.6	296.9±39.2	6.7±0.7	2293.7±305.6

血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) 公的溶出試験（局外規第三部「セチリジン塩酸塩錠の溶出規格」における溶出試験）

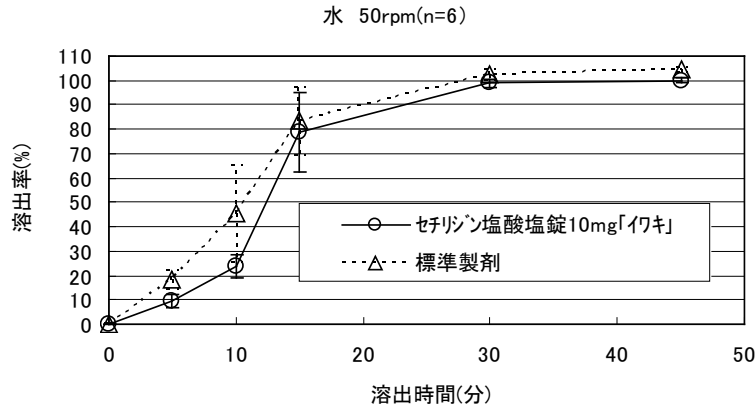
試験方法：日局溶出試験法第2法（パドル法）

条件：回転数 50 rpm

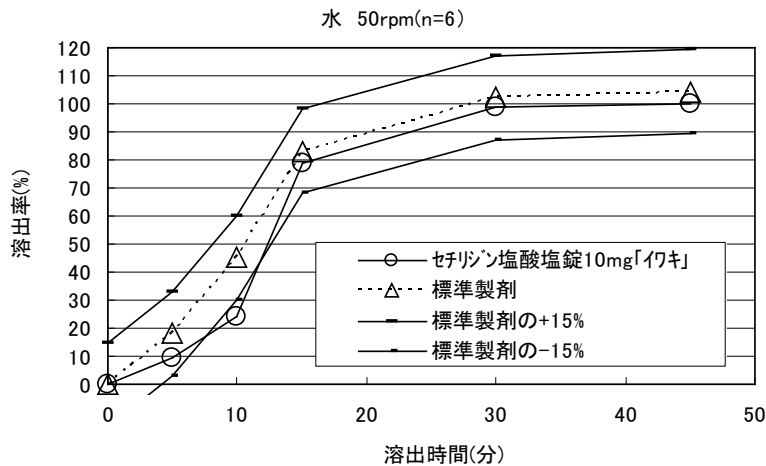
試験液：水

溶出規格：	製剤	規定時間	溶出率
	セチリジン塩酸塩錠 10mg	30分	85%以上

溶出曲線の検証：（グラフ1：溶出の様子）



（グラフ2：標準製剤の±15%表示）



溶出曲線の考察：溶出曲線について後発医薬品のガイドラインにおける溶出挙動の類似性を判定する時、水では標準製剤が15分～30分に平均85%溶出しており、標準製剤の平均溶出率が60%および85%付近の適当な2時点において、セチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±15%の範囲にある。（グラフ2）また、ガイドラインに従って求めたf2関数の値は68.6であり、ガイドラインに定めるところの45以上であった。以上から、セチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」の水における溶出挙動に標準製剤との類似性を認めた。

溶出試験結果：（セチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」の公的溶出試験30分での溶出率(%)）

	試験槽 1	試験槽 2	試験槽 3	試験槽 4	試験槽 5	試験槽 6	規格適合
ロット 1	99.9	101.0	99.9	100.4	101.0	102.6	適
ロット 2	99.4	101.5	100.4	101.5	96.7	98.8	適
ロット 3	99.9	96.1	101.0	100.4	97.2	99.9	適

セチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたセチリジン塩酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認された。

以上