

# ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」 溶出試験

## 溶出挙動に関する資料

共創未来ファーマ株式会社

## (1) 規格及び試験方法

ロピニロール徐放錠 8mg「KMP」は、設定された溶出規格に適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(回転バスケット法)

試験液：溶出試験第2液 900mL

回転数：100rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：4.5 時間、9 時間及び 24 時間後の溶出率がそれぞれ 13～37%、33～57%、70%以上のときは適合とする。

## (2) 生物学的同等性試験

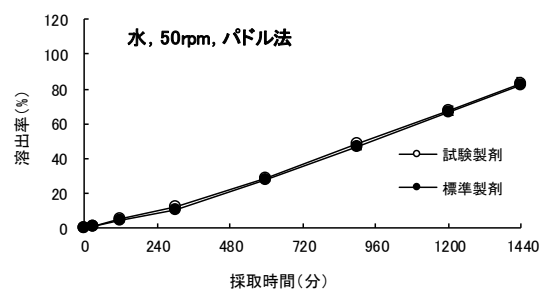
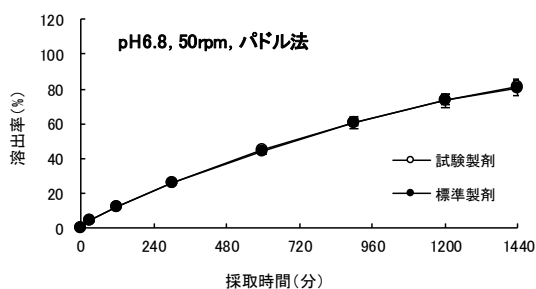
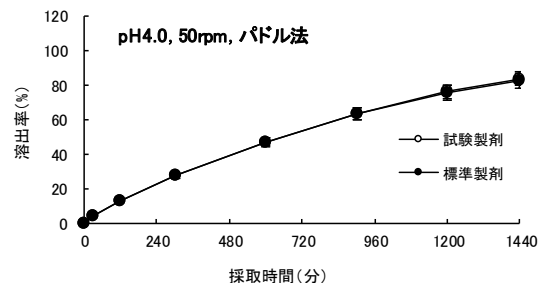
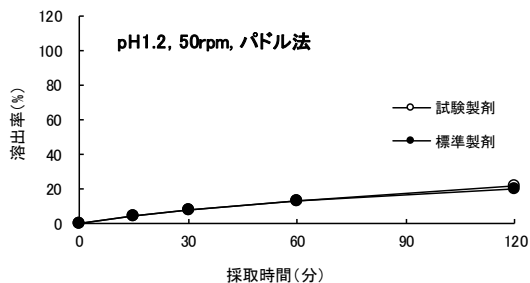
ロピニロール徐放錠 8mg「KMP」について、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号）（以下、ガイドライン）に従い、ヒトでの生物学的同等性が確認されたロピニロール徐放錠 2mg「KMP」を標準製剤として溶出試験を行い、生物学的同等性試験とした。なお、試験製剤の処方変更水準は、ガイドラインにより B 水準に該当した。

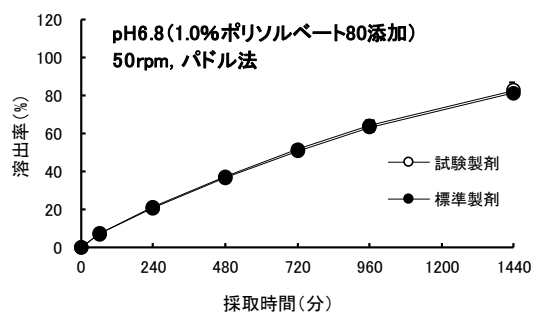
### <測定条件>

試 験 液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水  
pH6.8(1.0%ポリソルベート80含有)  
回 転 数：50rpm、100rpm、200rpm  
試験製剤：ロピニロール徐放錠8mg「KMP」

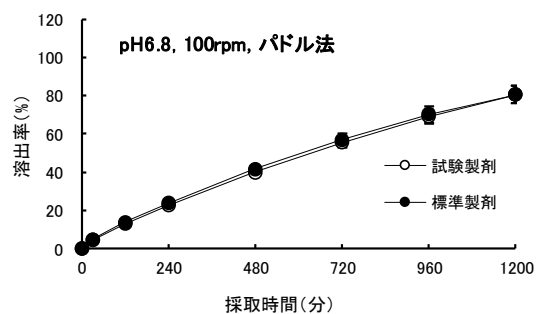
検 体 数：n=12

試 験 法：パドル法、回転バスケット法  
標準製剤：ロピニロール徐放錠2mg「KMP」

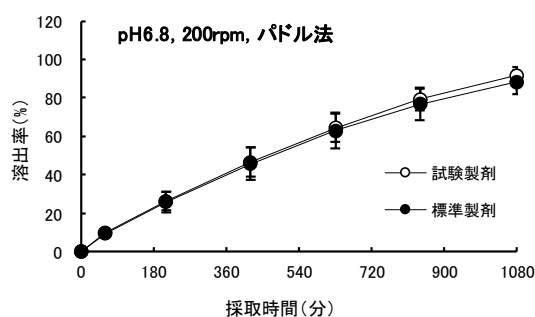




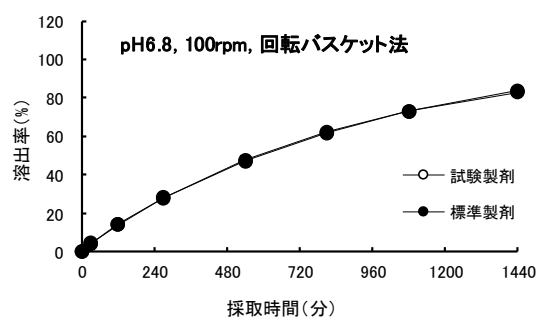
時間(分)	0	60	240	480	720	960	1440
試験製剤	0	7.3	21.3	37.3	51.5	64.0	82.5
標準偏差	0	0.2	0.5	1.2	2.1	3.0	4.0
標準製剤	0	7.2	20.9	36.7	50.8	63.3	81.2
標準偏差	0	0.2	0.4	0.8	1.3	2.1	2.0



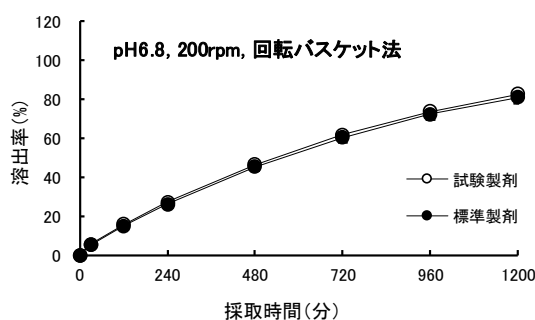
時間(分)	0	30	120	240	480	720	960	1200
試験製剤	0	4.6	13.1	22.6	39.9	55.6	69.3	80.6
標準偏差	0	0.2	0.4	0.7	1.7	2.8	3.7	4.5
標準製剤	0	5.0	14.0	24.0	41.6	57.1	70.3	80.6
標準偏差	0	0.2	0.5	0.8	1.8	3.0	4.1	4.5



時間(分)	0	60	210	420	630	840	1080
試験製剤	0	9.9	26.4	46.7	64.4	79.4	91.8
標準偏差	0	1.3	5.0	7.6	7.3	6.1	4.2
標準製剤	0	9.6	25.9	45.8	63.0	76.8	88.2
標準偏差	0	1.3	5.2	8.3	9.2	8.1	6.3



時間(分)	0	30	120	270	540	810	1080	1440
試験製剤	0	4.2	14.2	28.4	47.8	62.4	73.1	83.0
標準偏差	0	0.6	0.6	1.1	1.8	1.7	1.5	1.1
標準製剤	0	4.7	14.6	28.0	47.2	61.9	73.2	83.7
標準偏差	0	0.3	0.3	0.4	1.2	1.7	1.8	1.8



時間(分)	0	30	120	240	480	720	960	1200
試験製剤	0	5.5	15.7	27.1	46.4	61.7	73.5	82.5
標準偏差	0	0.2	0.6	0.9	0.8	1.4	1.9	2.1
標準製剤	0	5.1	15.0	26.1	45.1	60.3	72.0	80.6
標準偏差	0	0.3	0.8	1.1	1.9	2.5	3.0	3.1

① 試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

試験条件				平均溶出率(%)		平均 溶出率 の差 (%)	同等性の 判定基準	判定
試験 法	回転数 (rpm)	試験液	採取 時間 (分)	試験 製剤	標準 製剤			
パドル法	50	pH 1.2	30	8.3	7.9	0.4	標準製剤の平均溶出率の ±6%以内	適
			120	21.7	20.5	1.2		
		pH 4.0	300	27.7	27.7	0.0	標準製剤の平均溶出率の ±10%以内	適
			600	47.4	47.4	0.0		
			1440	84.1	83.0	1.1		
		pH 6.8	300	25.8	25.8	0.0		適
			600	44.9	44.6	0.3		
			1440	81.8	80.9	0.9		
		水	600	29.0	27.6	1.4		適
			900	48.2	46.5	1.7		
			1440	83.5	82.3	1.2		
		pH 6.8 +1.0%PS*	480	37.3	36.7	0.6		適
			720	51.5	50.8	0.7		
			1440	82.5	81.2	1.3		
	100	pH 6.8	240	22.6	24.0	-1.4		適
			720	55.6	57.1	-1.5		
			1200	80.6	80.6	0.0		
	200	pH 6.8	210	26.4	25.9	0.5		適
			420	46.7	45.8	0.9		
			840	79.4	76.8	2.6		
回転バスケット法	100	pH 6.8	270	28.4	28.0	0.4		適
			540	47.8	47.2	0.6		
			1440	83.0	83.7	-0.7		
	200	pH 6.8	240	27.1	26.1	1.0		適
			480	46.4	45.1	1.3		
			1200	82.5	80.6	1.9		

\*PS：ポリソルベート 80

(n=12)

②-1 最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率

試験条件				(a) 最小値 ～最大値 (%)	(b) 平均溶出率 ±9%の範囲 (%)	(a)が (b)を 超えた 数	同等性の 判定基準	判定
試験法	回転数 (rpm)	試験液	採取 時間 (分)					
パドル法	50	pH 1.2	120	21.0 ～22.3	12.7 ～30.7	0	最終比較時点における 個々の溶出率について、 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 えるものがない	適

(n=12)

②-2 最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率

試験条件				(a) 最小値～ 最大値 (%)	(b) 平均溶出率 ±15%の範囲 (%)	(a)が (b)を 超えた 数	同等性の 判定基準	判定
試験法	回転数 (rpm)	試験液	採取 時間 (分)					
パドル法	50	pH 4.0	1440	73.6～90.1	69.1～99.1	0	最終比較時点における 個々の溶出率について、 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 えるものがない	適
		pH 6.8	1440	73.2～86.9	66.8～96.8	0		適
		水	1440	79.6～89.7	68.5～98.5	0		適
		pH 6.8 +1.0% PS*	1440	70.6～86.8	67.5～97.5	0		適
	100	pH 6.8	1200	68.8～85.6	65.6～95.6	0		適
	200	pH 6.8	840	68.8～91.3	64.4～94.4	0		適
回転バスケット法	100	pH 6.8	1440	81.9～85.6	68.0～98.0	0	最終比較時点における 個々の溶出率について、 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 えるものがない	適
	200	pH 6.8	1200	79.7～85.8	67.5～97.5	0		適

\*PS：ポリソルベート 80

(n=12)

①②の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。従って、ロピニロール徐放錠 8mg「KMP」と標準製剤(ロピニロール徐放錠 2mg「KMP」)は、生物学的に同等であるとみなされた。