

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2018.10.25 初版

有効成分	アリルエストレノール		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	ペリアス錠 25mg	日本新薬
	2	コバレノール錠 25	小林化工
	3	メイエストン錠 25	東和薬品
	4	アリルエストレノール錠 25mg 「サワイ」	沢井製薬
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	（パーセリン錠 25mg）《販売中止》	（MSD）
効能・効果	http://www.bbdb.jp		
用法・用量	http://www.bbdb.jp		
添加物	http://www.bbdb.jp		
解離定数 ¹⁾	解離基を持たない。		
溶解度 ¹⁾ (37°C)	1.0%ポリソルベート 80 添加 pH1.2 : 0.9mg/mL pH4.0 : 0.9mg/mL pH6.8 : 0.8mg/mL 水 : 0.9mg/mL		
原薬の安定性 ¹⁾	水	なし	
	液性(pH)	なし	
	光	なし	
	その他	なし	
膜透過性	なし		
BCS・Biowaiver option	なし		
薬効分類	247 卵胞ホルモン及び黄体ホルモン剤		
規格単位	25mg 1錠		

【記載データ一覧】

	品目名	製造販売業者	BE	品質 再評価	溶出	検査
1	ペリアス錠25mg	日本新薬	○	○		
2	コバレノール錠25	小林化工	○	○		
3	メイエストン錠25	東和薬品	○	○		
4	ア ril エストレノール錠25mg「サワイ」	沢井製薬	○+	○*		

注)「BE」は、生物学的同等性(BE)試験結果を示し、○印がついているものは本情報集にデータを掲載している。○印の右に+印がついているものは動物試験のデータ。【3ページ】

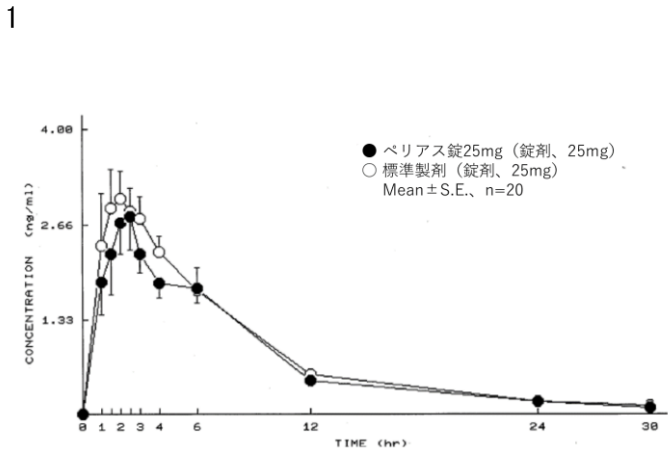
注)「品質再評価」の項目に○印がついているものは、品質再評価結果通知²⁾が発出されている品目である。空欄となっているものは、品質再評価指定以降に承認された品目等である。なお、参考として、品質再評価の際の先発医薬品(パーセリン錠25mg<<販売中止>>)の溶出曲線測定例を本情報集に掲載している。【4ページ】

注)「溶出」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である(上記表中の番号は、本情報集に掲載された溶出試験結果中の番号と対応している)。全品目で空欄となっている場合は、溶出試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【5ページ】

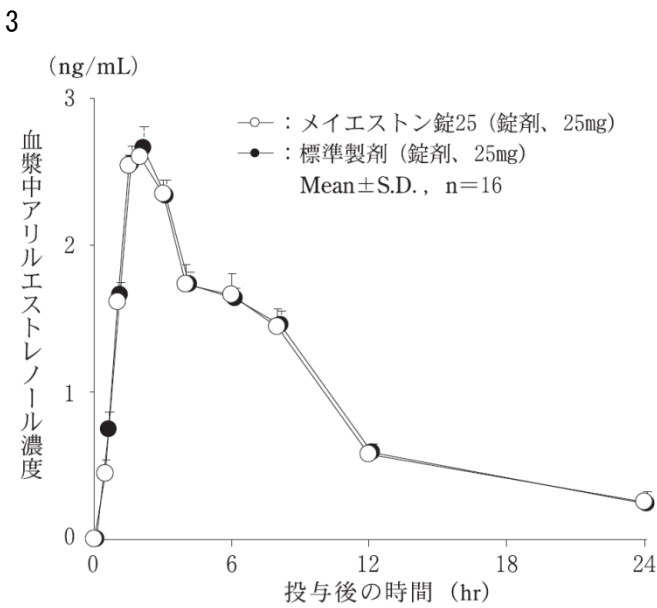
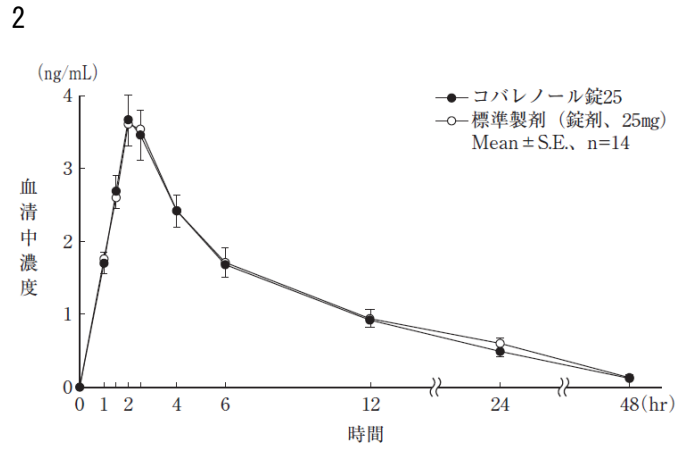
注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【6ページ】

*:旧販売名で記載

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】



(社内資料より)



4 <参考>
アリルエストレノール錠 25mg「サワイ」と標準製剤をビーグル犬にそれぞれ1錠(アリルエストレノールとして25mg)絶食時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中アリルエストレノール濃度を測定した。
得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

(インタビューフォームより)

【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

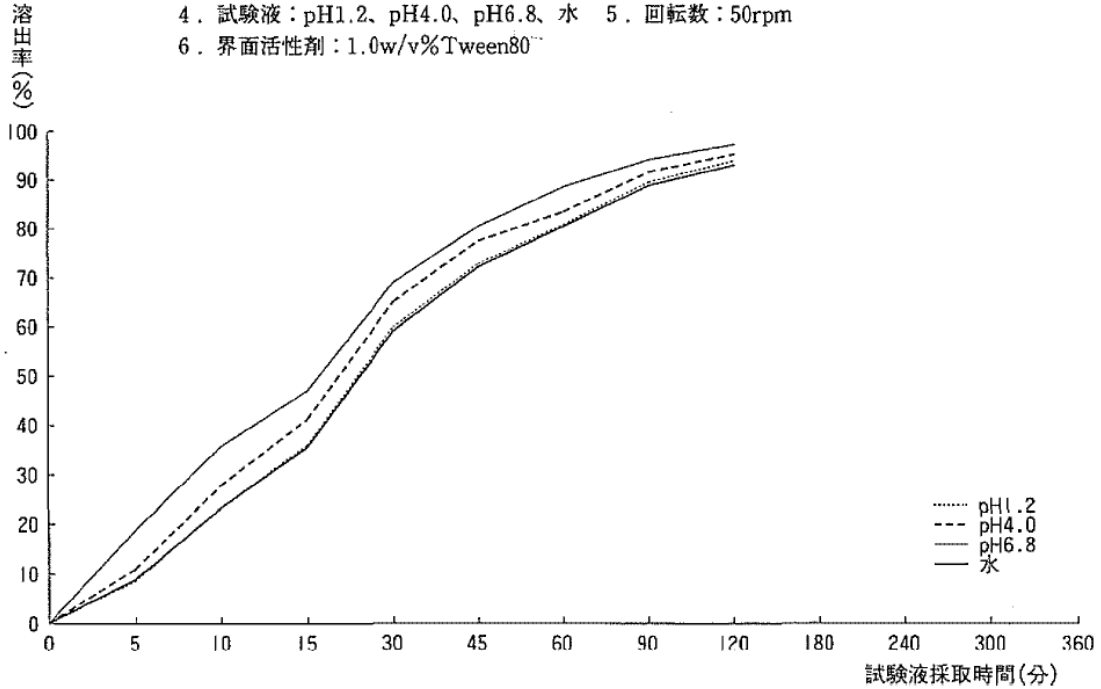
※先発医薬品（パーセリン錠 25mg≪販売中止≫）の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

ア ril エ ス ト レ ノ ール 錠 2 5 m g

パ ー セ リ ン 錠 2 5 m g

1. 有効成分名：ア ril エ ス ト レ ノ ール
2. 剤形：錠剤
3. 含量：25mg
4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
5. 回転数：50rpm
6. 界面活性剤：1.0w/v% Tween80



【溶出試験結果（ジェネリック医薬品品質情報検討会）】

なし

【後発医薬品品質確保対策事業検査結果】

なし

アリルエストレノール錠

Allylestrenol Tablets

溶出試験 本品1個をとり、試験液にポリソルベート80(1→100)900mLを用い、溶出試験法第2法により、毎分50回転で試験を行う。溶出試験を開始し、規定時間後、溶出液20mL以上をとり、孔径0.45μm以下のメンブランフィルターでろ過する。初めのろ液10mLを除き、次のろ液1mLを正確に量り、表示量に従い1mL中にアリルエストレノール(C₂₁H₃₂O)約28μgを含む液となるようにポリソルベート80(1→100)を加えて正確にV' mLとし、試料溶液とする。別にアリルエストレノール標準品を酸化リン(V)を乾燥剤として5時間減圧乾燥し、その約0.028gを精密に量り、メタノール25mLに溶かした後、ポリソルベート80(1→100)を加えて正確に50mLとする。この液5mLを正確に量り、ポリソルベート80(1→100)を加えて正確に100mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液10μLずつを正確にとり、次の条件で液体クロマトグラフ法により試験を行い、それぞれの液のアリルエストレノールのピーク面積A_T及びA_Sを測定する。

本品が溶出規格を満たすときは適合とする。

アリルエストレノール(C₂₁H₃₂O)の表示量に対する溶出率(%)

$$= W_s \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{V'}{V} \times \frac{1}{C} \times 90$$

W_s : アリルエストレノール標準品の量(mg)

C : 1錠中のアリルエストレノール(C₂₁H₃₂O)の表示量(mg)

試験条件

検出器 : 紫外吸光光度計(測定波長 : 210nm)

カラム : 内径4.6mm, 長さ15cmのステンレス管に5μmの液体クロマトグラフ用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする。

カラム温度 : 25℃付近の一定温度

移動相 : メタノール/水混液(199 : 1)

流量 : アリルエストレノールの保持時間が約5分になるように調整する。

システム適合性

システムの性能 : 標準溶液10μLにつき、上記の条件で操作するとき、アリルエストレノールのピークの理論段数及びシンメトリー係数は、それぞれ2500段以上、1.5以下である。

システムの再現性 : 標準溶液10μLにつき、上記の条件で試験を6回繰り返すとき、アリルエストレノールのピーク面積の相対標準偏差は1.0%以下である。

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
25mg	90分	75%以上

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) 医療用医薬品品質情報集（オレンジブック）（平成 15 年 10 月版、厚生労働省医薬食品局審査管理課）
- 2) 医療用医薬品再評価結果 平成 15 年度（その 2）について（平成 15 年 9 月 25 日付け薬食発第 0925003 号、厚生労働省医薬食品局長通知）
- 3) 日本薬局方外医薬品規格第三部の一部改正について（平成 15 年 9 月 25 日付け薬食発第 0925006 号、厚生労働省医薬食品局長通知）