

ジェネリック医薬品の溶出率の比較

Comparing leaching rate of Generic drugs

東京都立戸山高等学校 S S II 橋田 一輝

1. 動機

「薬物が生体にとってどの程度有効であるか」が同等であることを**生物学的同等性がある**と言
い、これはジェネリック医薬品が適切なものであるかを調べる際の一つの大きな指標となってい
る。また、決められた時間内に溶けだす有効成分の量(溶出率)を測定する**溶出試験**が生物学的同
等性の代替試験として活用できることが知られている。そこで今回は、ともにアセトアミノフェ
ンのジェネリック医薬品であるコカールとカロナールで溶出試験を行い、生物学的同等性を調べ
ることにした。

2. 実験の概要

コカールとカロナールを純水に溶かし、その水溶液とアセトアミノフェン標準溶液の吸光度の
違いを溶出時間ごとに調べて、p H1.2 と p H6.8 の緩衝液でも同様に実験を行った。また、同じ
アセトアミノフェンを主成分とする市販薬のタイレノールでも実験を行った。さらに参考として、
それぞれをすりつぶしたものでも溶出率を測定した。

3. 実験結果

水の溶出率は p H1.2 の溶出率よりも全体的に高くなる傾向があり、一方で p H6.8 の溶出率は
水の溶出率との大きな差異が見られなかった。また、溶出率の高さはカロナール>タイレノール
>>コカールの順に見られた。すりつぶしたものの測定値はコカールとカロナールで大きな違いは
なく、タイレノールは他と比べてアセトアミノフェンの含有量が多いため使用した器具の関係上、
うまく測定することができなかった。

4. 考察

カロナールもコカールも p H1.2 の緩衝液より、純水や p H6.8 の緩衝液に溶出する。これは胃
の中ではあまり溶けずに腸内で溶けだすことを裏付けている。また、カロナールとコカールの溶
出率に差が見られたが、すりつぶしたものは溶出率に差異はなかったが、いずれの添加物も水や
酸性溶液に溶けにくいものが多いので、崩壊の仕方によって溶出率に違いが出たのだと考えられ
る。薬をすりつぶした感触からも、錠剤の表面の硬さが最も崩壊の仕方に影響を与えたと推測さ
れる。

今回の溶出試験の実験結果を総合すると、コカール、カロナール、タイレノールでは生物学的
同等性がないという結論に至ってしまったものの、①実験方法が日本薬局方で定められている溶
出試験の方法を簡易化したものであったこと②溶出率は水温や攪拌子の位置などの僅かな違いで
も変化してしまう恐れがあるが正確にそれらを一定に保ち続けることが今回の実験では困難であ
ったことから、必ずしもそうであると言い切ることはできないので、機会があれば実際に行われ
ている方法でもやってみたいと思った。

5. 参考文献

第 14 改正日本薬局方<<http://jpdb.nihs.go.jp/jp14/>>