

エパルレスタット錠 50mg 「タカタ」
生物学的同等性試験

販 売 元：（株）三和化学研究所

製造販売元：高田製薬（株）

生物学的同等性試験

エパルレスタット錠 50mg「タカタ」と標準製剤（錠剤、50mg）との生物学的同等性を評価するため、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成9年12月22日医薬審第487号および平成13年5月31日付医薬審発第786号）」に従い、溶出挙動の同等性を評価した後、健康成人男子志願者を被験者とした2剤2期のクロスオーバー法により両製剤を絶食下单回経口投与し、投与後8時間までのエパルレスタットの血漿中濃度から、バイオアベイラビリティを比較した。

(1) 使用薬剤

試験製剤：エパルレスタット錠 50mg「タカタ」

標準製剤：錠剤、50mg

(2) 被験者

健康成人男子志願者 24 名を無作為に 2 群に振り分けた。

なお、1 名は試験途中で脱落となったため今回の結果は 23 名で解析を行った。

(3) 試験デザイン

治験デザインについては、被験者の違いによる変動を全体の変動の中から取り除くことができる2剤2期のクロスオーバー法のデザインを選択した。

(4) 投与量及び投与方法

投与前日の夕食後から10時間以上絶食後の翌朝の空腹時、試験製剤又は標準製剤1錠を水150mLとともに服用させた。（投与量は、標準製剤で承認されている用法・用量の範囲内である成人1回あたりの臨床常用量とした。）

(5) 採血時間

投与前、投与後0.5、1、1.5、2、3、4、5、6および8時間に前腕静脈から採血した。

(6) 測定法

液体クロマトグラフィーにて測定した。

(7) 結果

エパルレスタット錠 50mg「タカタ」及び標準製剤（錠剤、50mg）の投与後のエパルレスタット血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて対数値の平均値の差の90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータは $\log 0.8 \sim \log 1.25$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。

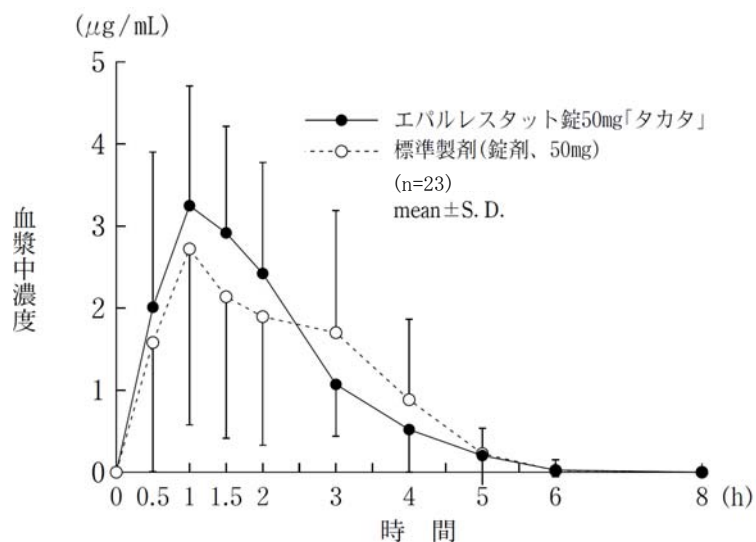


図1 エパルレスタット錠 50mg「タカタ」と標準製剤投与後のエパルレスタットの平均血漿中濃度推移

表1 薬物動態のパラメータ

| 製剤 | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|---------------------|--|-------------------------------------|--------------|-------------------------|
| | AUCt ($\mu\text{g}\cdot\text{h}/\text{mL}$) | Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$) | t max (h) | t _{1/2} (h) |
| エパルレスタット錠 50mg「タカタ」 | 7.74±1.96 | 4.18±1.10 | 1.5±1.1 | 0.7±0.3 |
| 標準製剤 (錠剤、50mg) | 7.49±2.60 | 4.26±1.38 | 1.7±1.1 | 0.7±0.2 |

(mean±S. D., n=23)

※血漿中濃度並びに AUC、Cmax 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。

表2 統計解析結果

| パラメータ | AUCt | Cmax | 判定基準 | 判定 |
|---------|-------------------------|-------------------------|----------------------|----|
| 90%信頼区間 | log(0.975) ~ log(1.135) | log(0.869) ~ log(1.160) | log(0.8) ~ log(1.25) | 適 |

※両製剤の AUCt と Cmax の対数値の平均値の差の 90%信頼区間が、log(0.8) ~ log(1.25) の範囲にあるとき、両製剤は生物学的に同等と判断した。