

エバスチンOD錠5mg「タイヨー」の 生物学的同等性試験

1. 試験目的

エバスチンOD錠5mg「タイヨー」は、エバスチンを主薬とする持続性選択H₁受容体拮抗剤の口腔内崩壊錠である。今回、本製剤の生物学的同等性試験を実施したので報告する。

2. 試験方法

被験者：健康成人男子

投与方法：クロスオーバー法 水150mLと共に絶食単回経口投与(水で服用試験)
水なしで絶食単回経口投与(水なしで服用試験)

投与量：1錠(エバスチンとして5mg)

標準製剤：大日本住友製薬(株)製造販売 エバステルOD錠5mg
(現在の製造販売名・会社と異なる場合があります)

試験実施期間：平成18年3月7日～平成18年9月13日

測定対象：血漿中活性代謝物(カレバスチン)濃度

測定方法：LC/MS/MS法

3. 試験結果

(1) 水で服用試験

得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

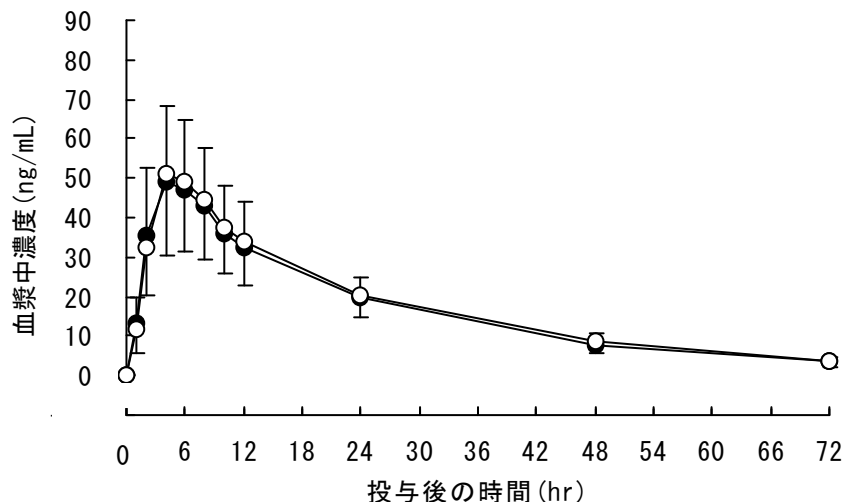


図1 平均血漿中濃度推移

○：自社製剤、●：標準製剤、n=16、平均±標準偏差

表1 薬物動態パラメータ (n=16、平均±標準偏差)

	投与量(mg)	AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
自社製剤	5	1277.5±329.0	52.1±17.0	4.9±1.5	20.0±2.4
標準製剤	5	1230.6±344.0	49.8±18.3	4.6±1.2	19.2±3.1

AUC₀₋₇₂：0～72時間の血漿中濃度-時間曲線下面積、C_{max}：最高血漿中濃度

T_{max}：最高血漿中濃度到達時間、T_{1/2}：消失半減期

表2 同等性の判定結果

項目	C _{max}	AUC ₀₋₇₂
母平均の比	1.05	1.04
90%信頼区間	$\log(0.94) \sim \log(1.17)$	$\log(0.94) \sim \log(1.15)$
判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$	適合	適合

(2) 水なしで服用試験

得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

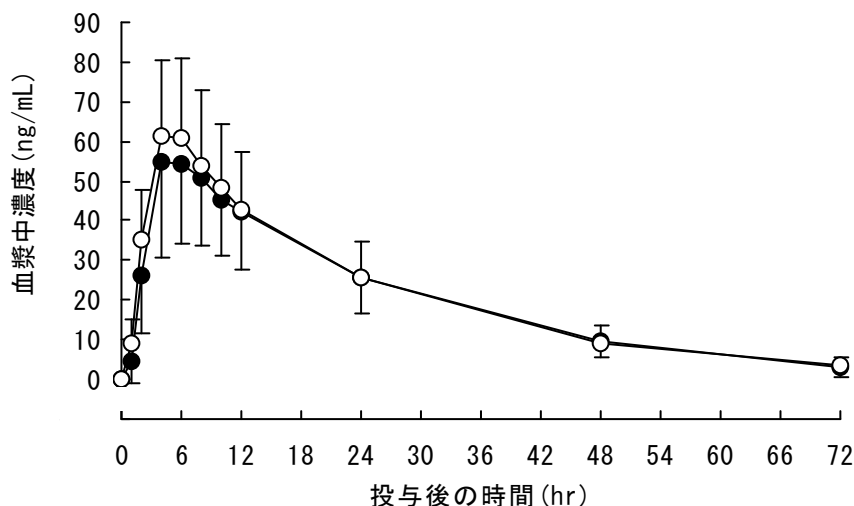


図2 平均血漿中濃度推移

○：自社製剤、●：標準製剤、n=10、平均±標準偏差

表3 薬物動態パラメータ (n=10、平均±標準偏差)

	投与量(mg)	AUC ₀₋₇₂ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
自社製剤	5	1541.2±513.0	63.0±19.8	4.6±1.0	16.8±1.9
標準製剤	5	1482.8±506.8	61.8±17.7	6.0±2.5	16.7±2.0

AUC₀₋₇₂：0～72時間の血漿中濃度－時間曲線下面積、Cmax：最高血漿中濃度

Tmax：最高血漿中濃度到達時間、T_{1/2}：消失半減期

表4 同等性の判定結果

項目	Cmax	AUC ₀₋₇₂
母平均の比	1.02	1.05
90%信頼区間	$\log(0.86) \sim \log(1.20)$	$\log(0.91) \sim \log(1.21)$
判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$	適合	適合

図3-1 各被験者の血漿中濃度推移(水で服用試験)

○ : エバスチンOD錠5mg「タイヨー」、● : エバステルOD錠5mg

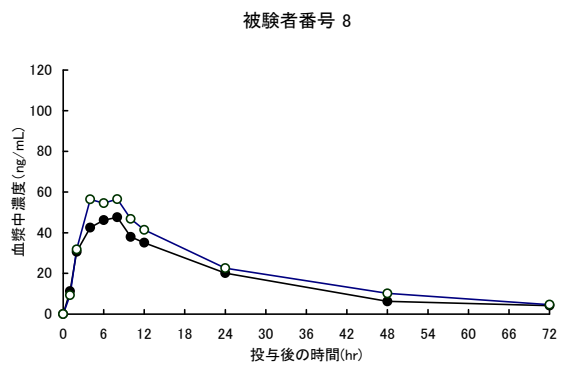
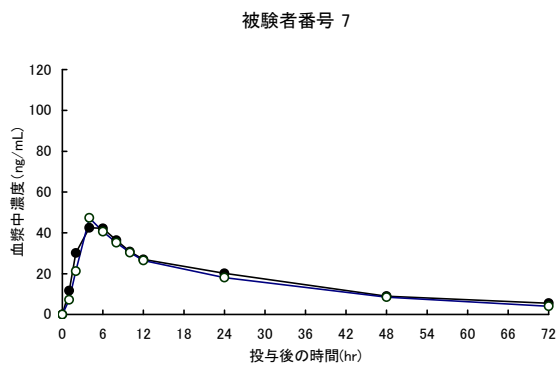
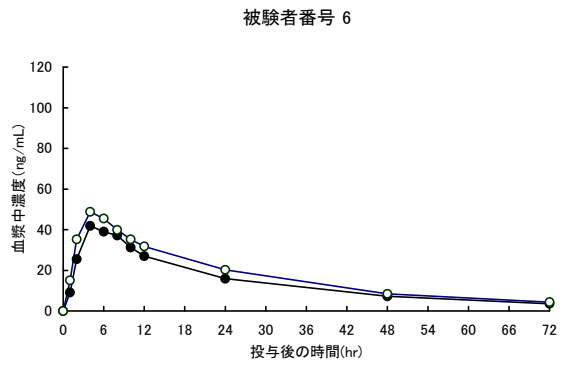
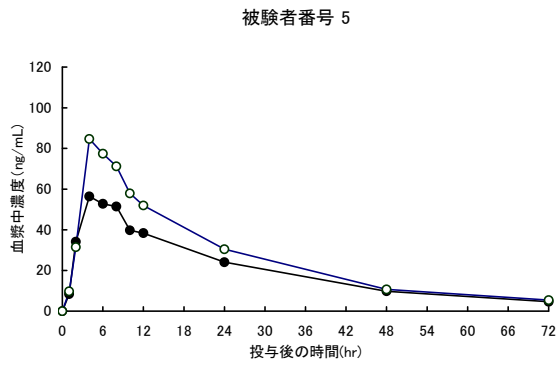
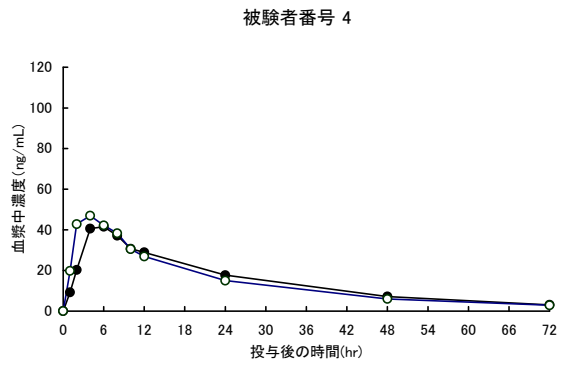
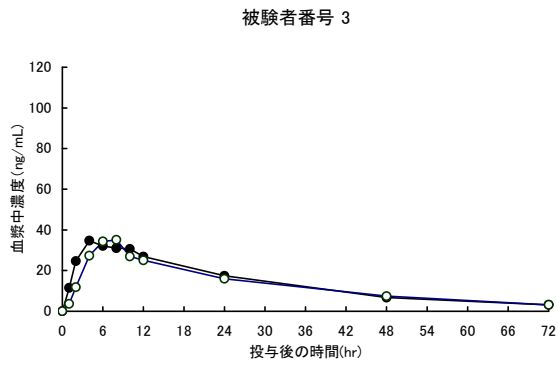
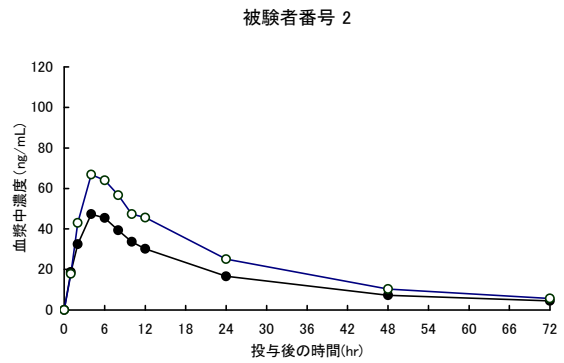
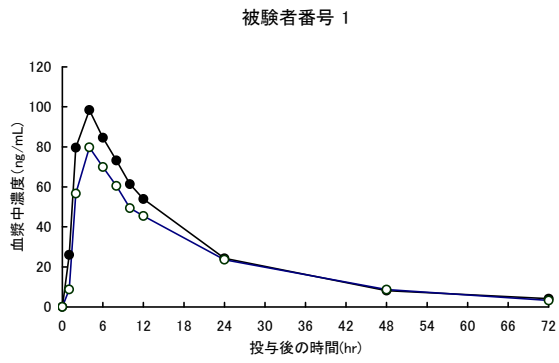


図3-2 各被験者の血漿中濃度推移(水で服用試験)

○ : エバスチンOD錠5mg 「タイヨー」、● : エバステルOD錠5mg

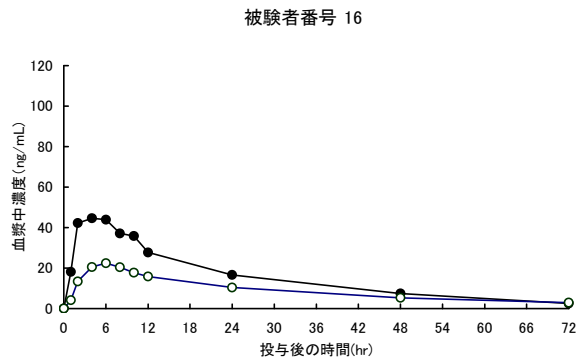
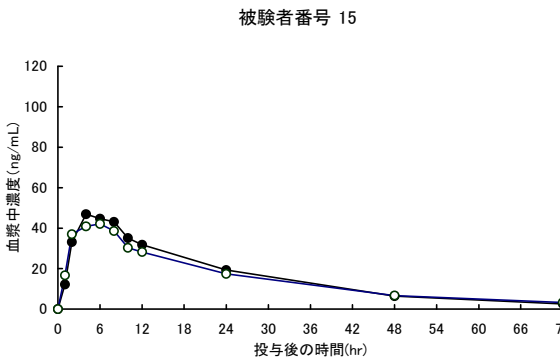
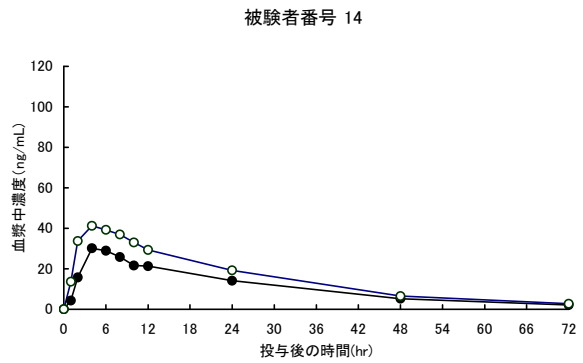
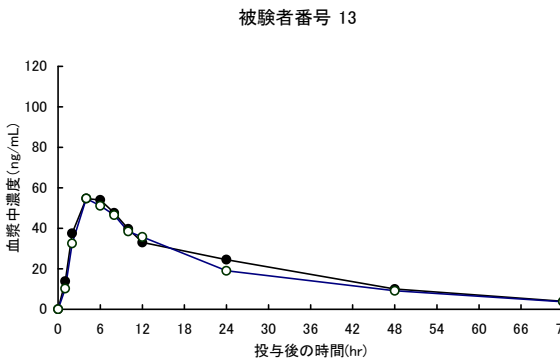
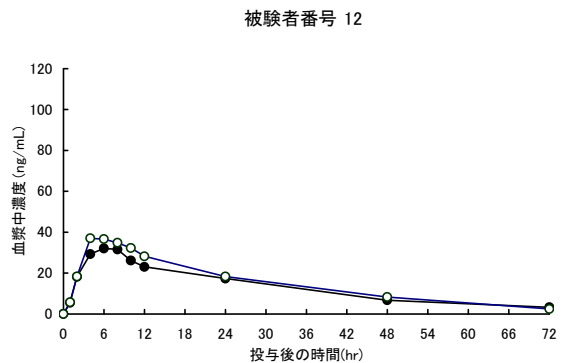
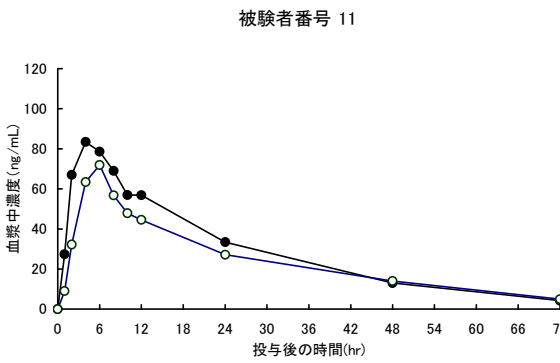
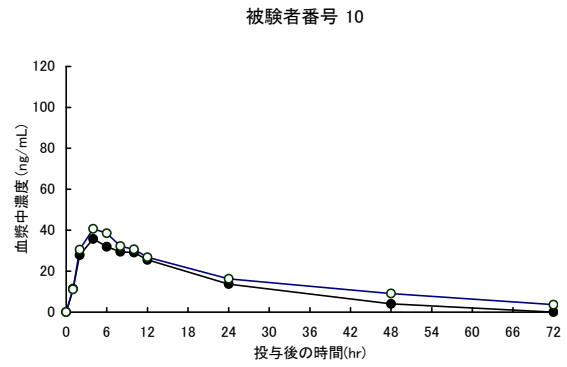
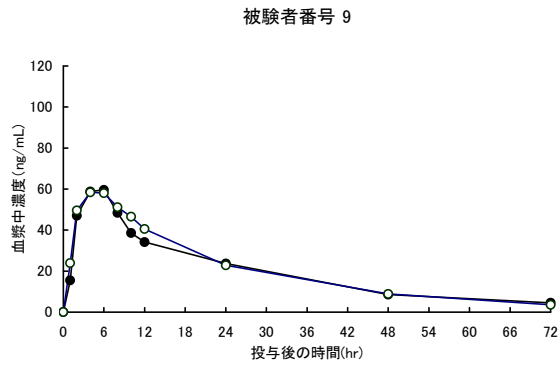


図4 各被験者の血漿中濃度推移(水なしで服用試験)

○ : エバスチンOD錠5mg「タイヨー」、● : エバステルOD錠5mg

