

## グリメピリドOD錠3mg「タイヨー」の 生物学的同等性試験

### 1. 試験目的

グリメピリドOD錠3mg「タイヨー」は、スルホニルウレア系経口血糖降下剤で、グリメピリドを主薬とする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

(水で服用試験) 水150mLと共に食後単回経口投与

(水なしで服用試験) 自社製剤は水なしで、標準製剤は水150mLと共に食後単回経口投与

投与量：1錠(グリメピリドとして3mg)

標準製剤：グリメピリド3mg 錠剤

試験実施期間：2005年1月13日～2009年3月23日

測定対象：血清中未変化体濃度

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、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。

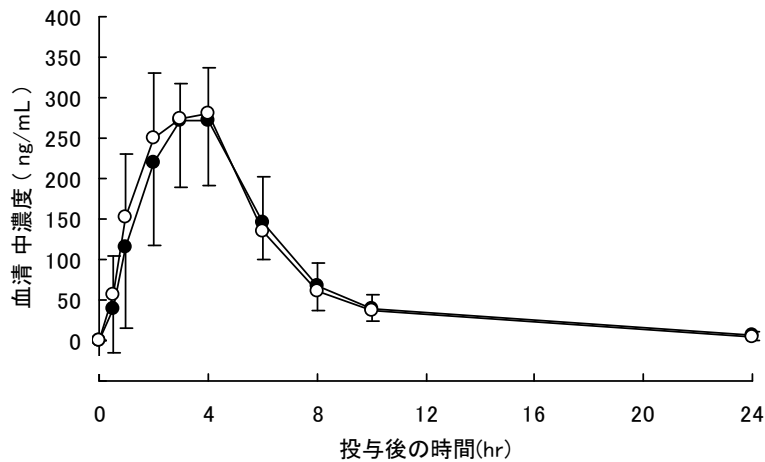


図1 平均血清中濃度推移

○：自社製剤、●：標準製剤、n=15、平均±標準偏差

表1 薬物動態パラメータ (n=15、平均±標準偏差)

	投与量(mg)	AUC <sub>0-24</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
自社製剤	3	1801.7±356.7	311.4±46.5	3.1±0.9	4.05±1.44
標準製剤	3	1789.4±442.4	307.2±75.4	3.1±1.0	4.07±1.62

AUC<sub>0-24</sub>：0～24時間の血清中濃度-時間曲線下面積、Cmax：最高血清中濃度

Tmax：最高血清中濃度到達時間、T<sub>1/2</sub>：消失半減期

表2 同等性の判定結果

項目	Cmax	AUC <sub>0-24</sub>
母平均の比	log(1.04)	log(1.02)
90%信頼区間	log(0.97)～log(1.12)	log(0.96)～log(1.09)
判定基準[log(0.80)～log(1.25)]	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。

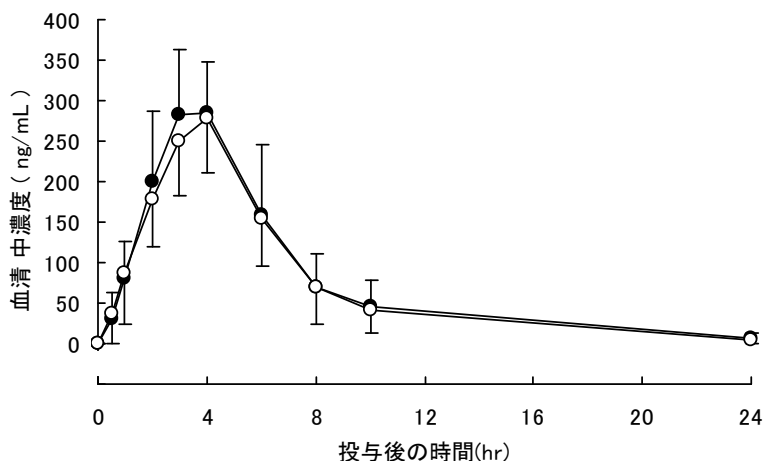


図2 平均血清中濃度推移

○：自社製剤、●：標準製剤、n=16、平均±標準偏差

表3 薬物動態パラメータ (n=16、平均±標準偏差)

	投与量 (mg)	AUC <sub>0-24</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
自社製剤	3	1756.7 ± 473.7	294.7 ± 69.8	3.8 ± 0.8	3.82 ± 1.53
標準製剤	3	1846.3 ± 502.8	312.3 ± 66.1	3.4 ± 0.9	4.36 ± 1.73

AUC<sub>0-24</sub>：0～24時間の血清中濃度－時間曲線下面積、Cmax：最高血清中濃度

Tmax：最高血清中濃度到達時間、T<sub>1/2</sub>：消失半減期

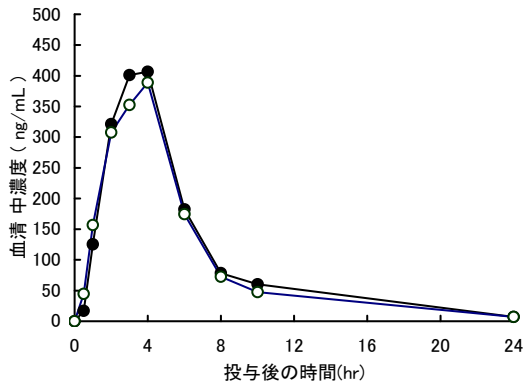
表4 同等性の判定結果

項目	Cmax	AUC <sub>0-24</sub>
母平均の比	$\log(0.94)$	$\log(0.95)$
90%信頼区間	$\log(0.84) \sim \log(1.05)$	$\log(0.90) \sim \log(1.01)$
判定基準 [ $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ ]	適合	

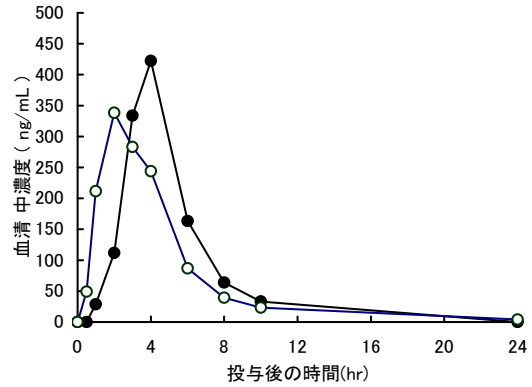
図3-1 各被験者の血清中濃度推移(水で服用試験)

○：グリメピリドOD錠3mg「タイヨー」、●：標準製剤

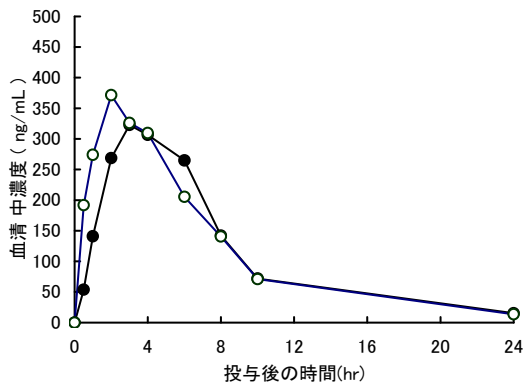
被験者番号 M01



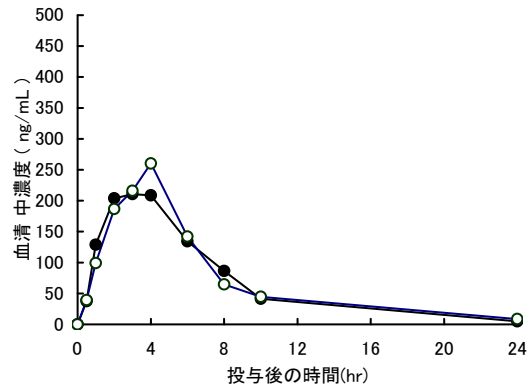
被験者番号 M02



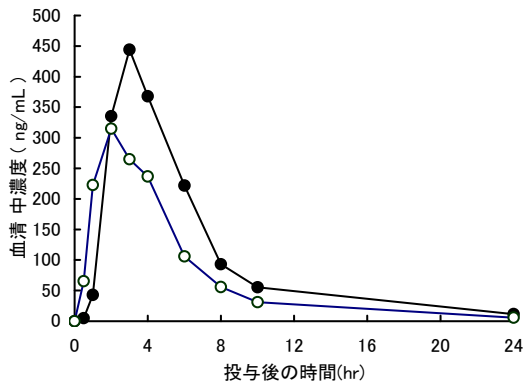
被験者番号 M03



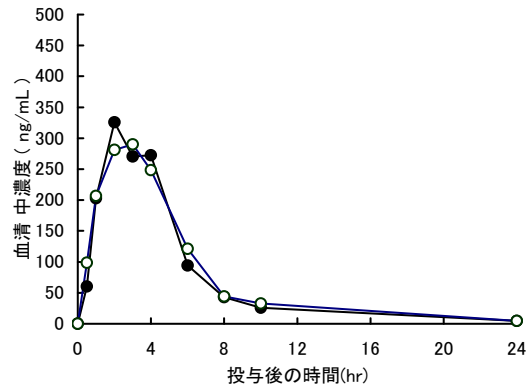
被験者番号 M04



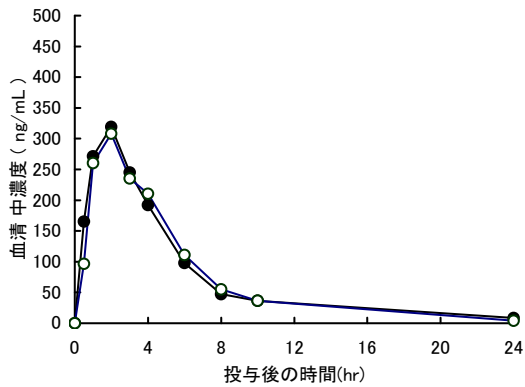
被験者番号 M05



被験者番号 M06



被験者番号 M07



被験者番号 M08

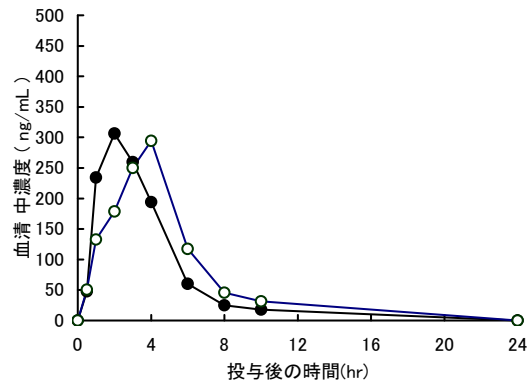
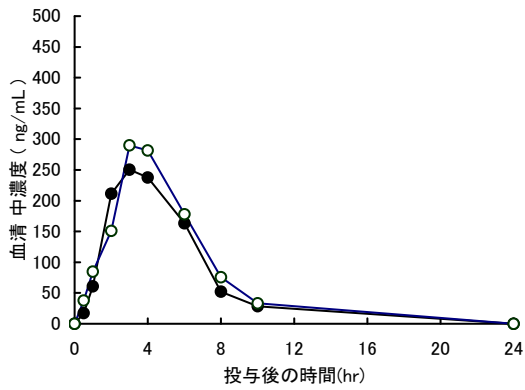


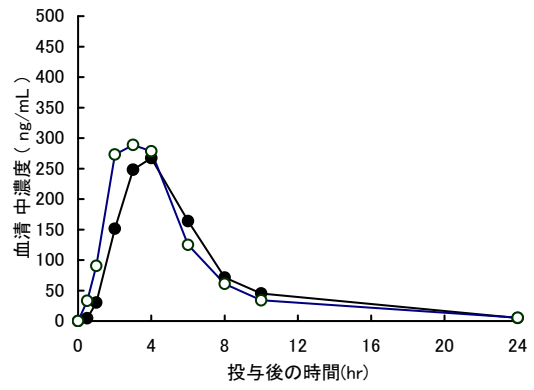
図3-2 各被験者の血清中濃度推移(水で服用試験)

○：グリメピリドOD錠3mg「タイヨー」、●：標準製剤

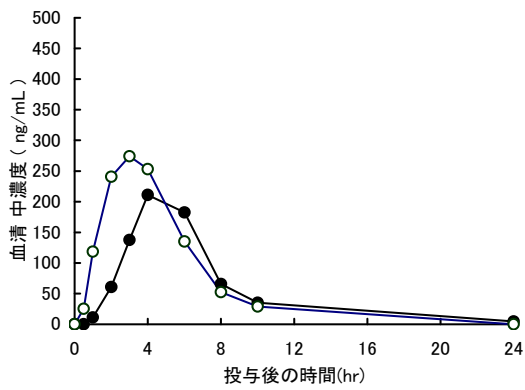
被験者番号 N01



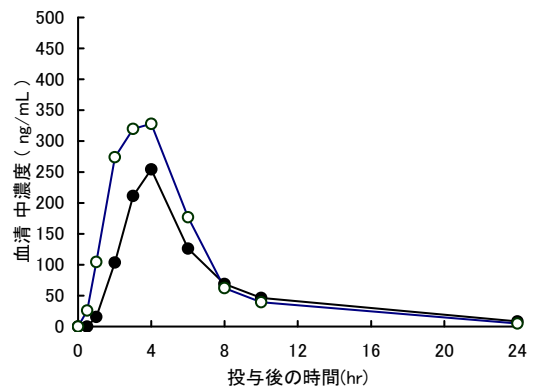
被験者番号 N02



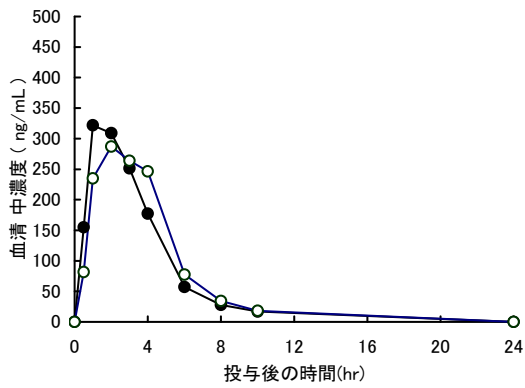
被験者番号 N03



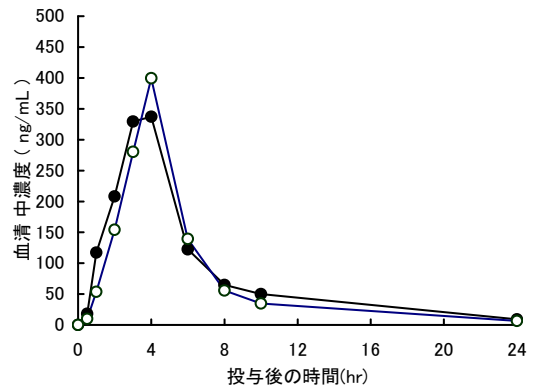
被験者番号 N04



被験者番号 N05



被験者番号 N06



被験者番号 N07

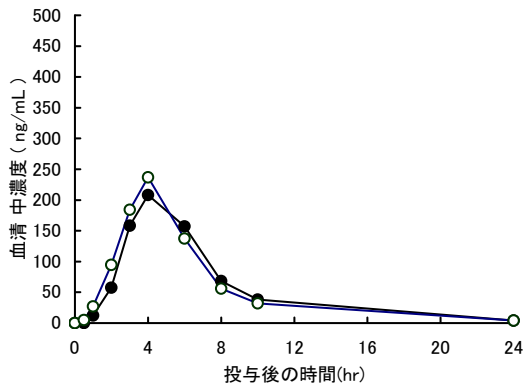
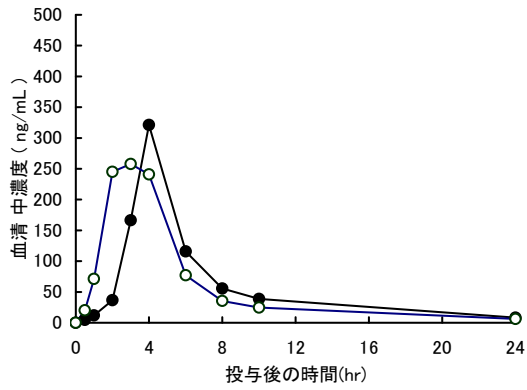


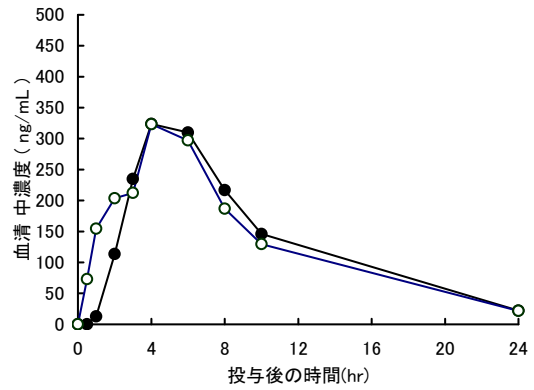
図4-1 各被験者の血清中濃度推移(水なしで服用試験)

○：グリメピリドOD錠3mg「タイヨー」、●：標準製剤

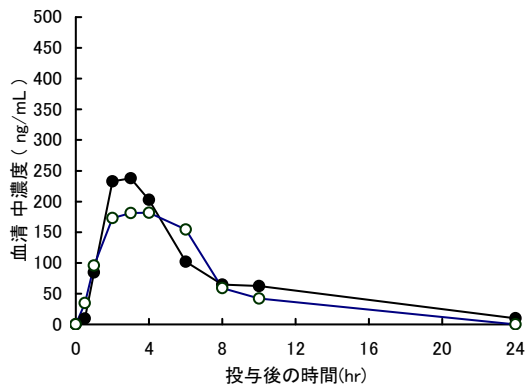
被験者番号 I01



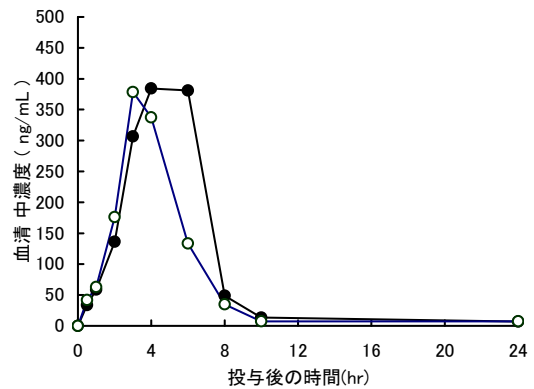
被験者番号 I02



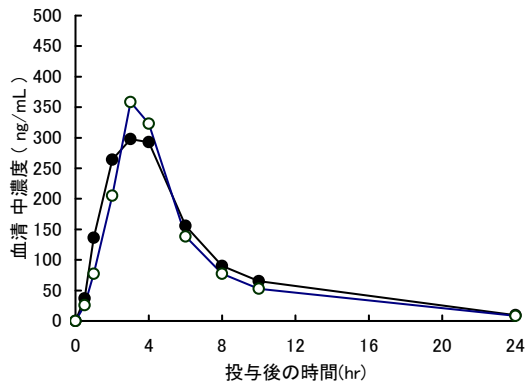
被験者番号 I03



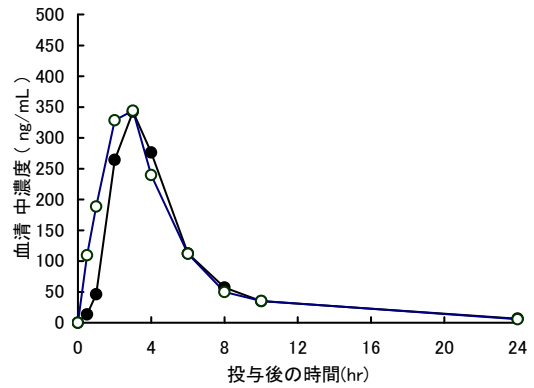
被験者番号 I04



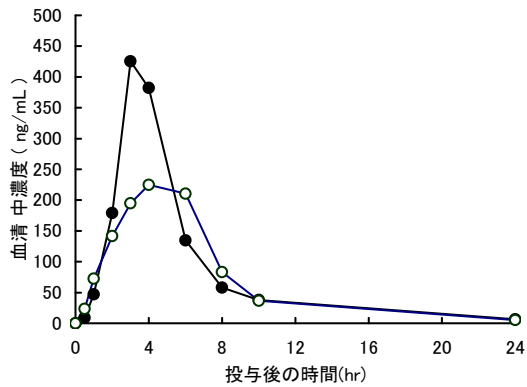
被験者番号 I05



被験者番号 I06



被験者番号 I07



被験者番号 I08

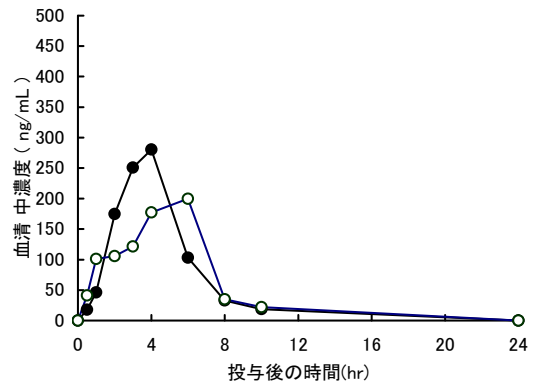
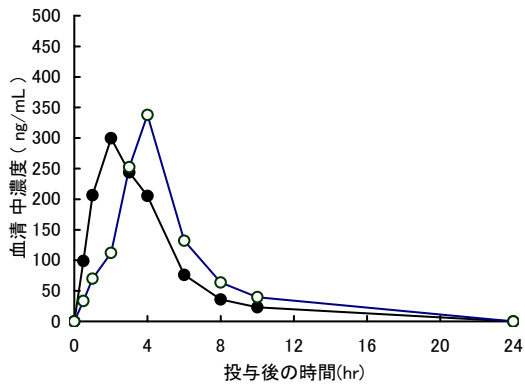
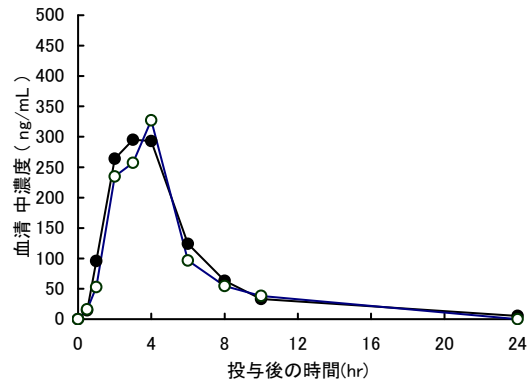


図4-2 各被験者の血清中濃度推移(水なしで服用試験)  
 ○：グリメピリドOD錠3mg「タイヨー」、●：標準製剤

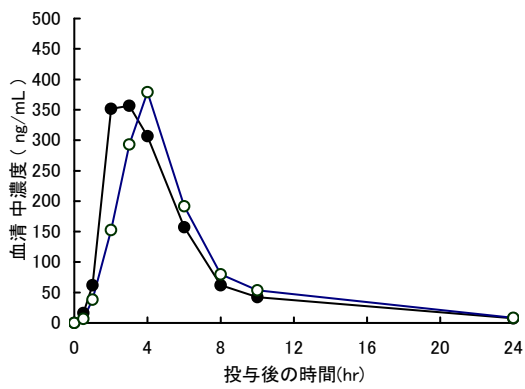
被験者番号 J01



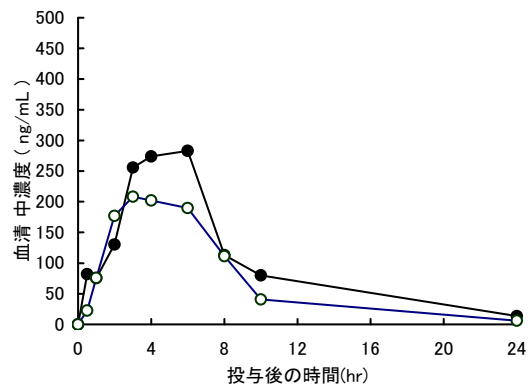
被験者番号 J02



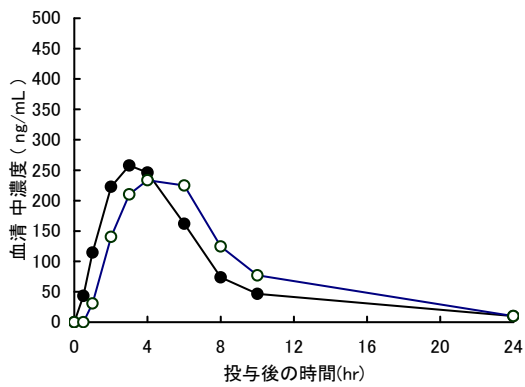
被験者番号 J03



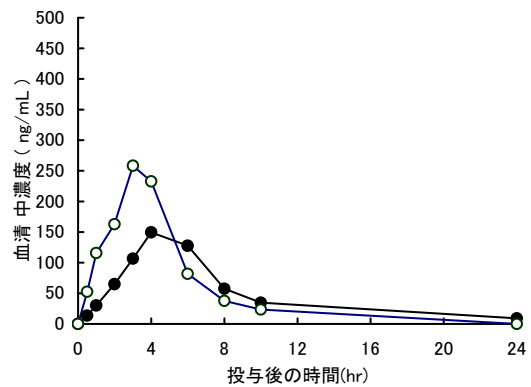
被験者番号 J04



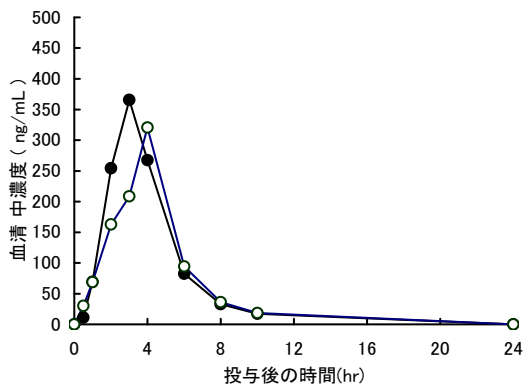
被験者番号 J05



被験者番号 J06



被験者番号 J07



被験者番号 J08

