

シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%「タイヨー」 の生物学的同等性試験

試験実施期間：平成5年10月23日～平成6年1月14日

1. 試験目的

シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%「タイヨー」は、シプロヘプタジン塩酸塩水和物を主薬とする抗アレルギー剤である。今回、本製剤の生物学的同等性試験を実施した。すなわち、日医工(株)製のペリアクチンシロップ0.04%を標準製剤として健康成人に経口投与し、投与後の血清中未変化体濃度を高速液体クロマトグラフ法により測定したので報告する。

2. 試験方法

(1) 被験者

あらかじめ本試験の目的、内容について説明を受け、その趣旨を十分に理解し、自主的に参加を志願(書面により同意)した者のうち、医師より健康と認められた成人男子14名を被験者とした。

被験者の背景 14名(年齢20～26歳、体重51.0～68.0kg)

(2) 投与・採血方法

被験者14名は、1群7名の2群に分け、1週間の休薬期間を設けたクロスオーバー法により、シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%「タイヨー」又はペリアクチンシロップ0.04%各10mL(シプロヘプタジン塩酸塩無水物として4mg)を水100mLと共に絶食下経口投与した。採血は、投与前、投与後0.25、0.5、1、2、4、6、8及び24時間を実施し、血清を分取後、分析時まで凍結保存した。

3. 血清中濃度測定法

血清中の未変化体の定量は、Novak¹⁾及びHuckerら²⁾の方法を参考にし、高速液体クロマトグラフ法により行った。

4. 血清中濃度測定結果

シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%「タイヨー」又はペリアクチンシロップ0.04%を投与した後の平均血清中濃度推移並びに薬物速度論的パラメータを図及び表に示す。

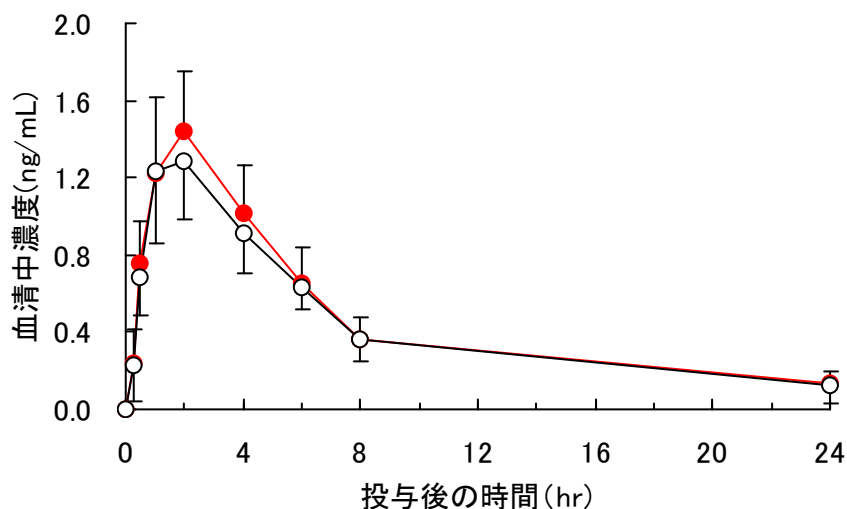


図 平均血清中濃度推移

(○ : シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%「タイヨー」,
● : ペリアクチンシロップ0.04%, n=14, 平均±標準偏差)

表 薬物速度論的パラメータ (n=14, 平均±標準偏差)

	T _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)
シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%「タイヨー」	1.4±0.5	1.46±0.31	8.2±4.4	10.41±2.00
ペリアクチンシロップ0.04%	1.6±0.5	1.56±0.27	8.3±4.2	11.09±2.24

T_{max} : 最高血清中濃度到達時間, C_{max} : 最高血清中濃度, T_{1/2} : 消失半減期
AUC₀₋₂₄ : 0~24時間の血清中濃度-時間曲線下面積

5. 結論

シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%「タイヨー」とペリアクチンシロップ0.04%は、経口投与後の血清中濃度に有意差が認められず、生物学的に同等と判断された。これにより、両製剤は、投与後の治療効果も同等と考えられた。

6. 参考文献

- 1) E. A. Novak : J. Chromatogr., **339**, 457 (1985).
- 2) H. B. Hucker et al. : J. Pharm. Sci., **72**, 1069 (1983).