

サラゾスルファピリジン錠500mg「タイヨー」の生物学的同等性試験

試験実施期間：平成7年5月19日～平成7年5月28日

1. 試験目的

サラゾスルファピリジン錠500mg「タイヨー」は、サラゾスルファピリジンを主薬とする潰瘍性大腸炎治療剤である。今回、本製剤の生物学的同等性試験を実施した。すなわち、ファイザー(株)製のサラゾピリン錠を対照薬として健康成人に経口投与し、投与後の未変化体血漿中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、安全性など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、医師より健常と認められた成人男子24名を被験者とした。

(2) 投与・採血方法

被験者24名は、1群12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エミナピリン錠又はサラゾピリン錠各1錠(サラゾスルファピリジンとして500mg)を水180mLと共に経口投与した。採血は、投与前、投与後1, 2, 3, 4, 5, 6, 8, 10, 12及び24時間に実施し、血漿を分取後、分析時まで凍結保存した。なお、投与前12時間から投与後4時間は絶食とした。

3. 血漿中濃度測定法

血漿中の未変化体の定量は、内田ら¹⁾及びAstbury²⁾の方法を参考にし、液体クロマトグラフ法により行った。

4. 血漿中濃度測定結果

サラゾスルファピリジン錠500mg「タイヨー」又はサラゾピリン錠を投与した後の平均血漿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。

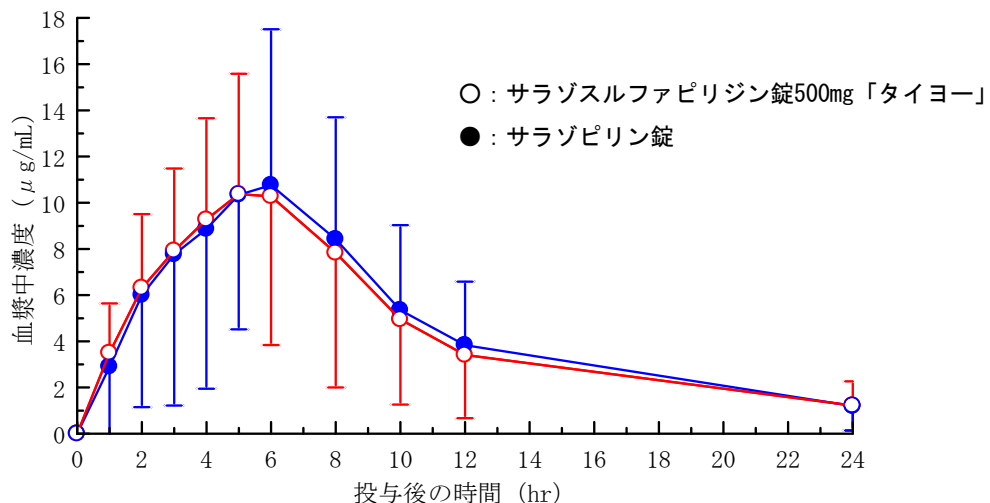


図 平均血漿中濃度推移 (n=24, 平均±標準偏差)

表 薬物速度論的パラメータ (n=24, 平均±標準偏差)

	Tmax (hr)	Cmax (μ g/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC ₀₋₂₄ (μ g·hr/mL)
サラゾスルファピリジン錠 500mg 「タイヨー」	4.6±1.1	11.8±6.3	7.3±1.1	109.6±66.9
サラゾピリン錠	5.1±1.4	12.0±7.1	6.7±1.1	113.6±75.4

Tmax : 最高血漿中濃度到達時間, Cmax : 最高血漿中濃度, T_{1/2} : 消失半減期

AUC₀₋₂₄ : 0~24時間の血漿中濃度-時間曲線下面積

5. 結論

サラゾスルファピリジン錠500mg「タイヨー」とサラゾピリン錠は、経口投与後の血漿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) 内田 英二ら : 臨床薬理, **21(2)**, 377 (1990).
- 2) C. Astbury : J. Pharm. Biomed. Anal., **6(1)**, 103 (1988).