

## ロペラミド塩酸塩カプセル1mg「タイヨー」の 生物学的同等性試験

試験実施期間：昭和63年1月 20日～昭和63年3月11日

### 1. 試験目的

ロペラミド塩酸塩カプセル1mg「タイヨー」は、塩酸ロペラミドを主薬とする止瀉剤である。今回、本製剤の生物学的同等性試験についてイヌを用いて実施した。すなわち、大日本製薬(株)製のロペミンカプセルを対照薬としてイヌにクロスオーバー法により強制経口投与し、投与後の未変化体血清中濃度をガス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) 使用動物

体重9.3～11.8kgの雄性ビーグル犬10頭を使用した。

#### (2) 投与・採血方法

ビーグル犬10頭は、1群5頭の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、ロペラニールカプセル1mgまたはロペミンカプセル（いずれも1カプセル中塩酸ロペラミド1mg含有）5カプセルを水20mLと共に強制経口投与した。採血は投与前、投与後1、2、4、6、8、10、24及び48時間に前肢静脈より経時的に採血し、血清を分取した。

### 3. 血清中濃度測定結果

ロペラミド塩酸塩カプセル1mg「タイヨー」またはロペミンカプセルを経口投与した後の平均未変化体血清中濃度推移並びに薬物速度論的パラメータを図1及び表1に示す。

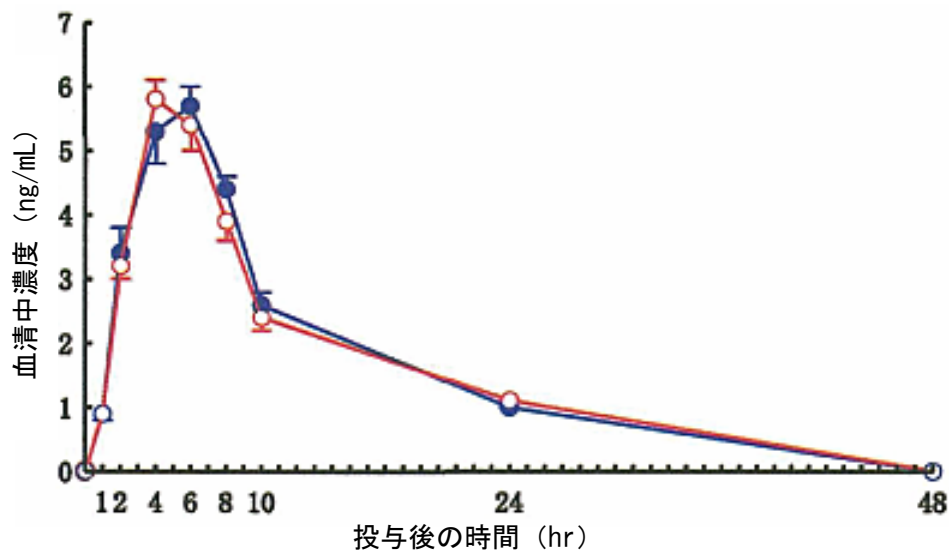


図1 平均血清中濃度推移 (n=10、平均±S. E.)

○：ロペラミド塩酸塩カプセル1mg「タイヨー」、●：ロペミンカプセル

表1 薬物速度論的パラメータ (n=10、平均±S. E.)

	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-48</sub> (ng・hr/mL)
ロペラミド塩酸塩カプセル 1mg「タイヨー」	4.6±0.3	6.1±0.3	9.4±0.4	76.0±2.6
ロペミンカプセル	5.0±0.3	6.2±0.3	8.2±0.3	77.2±2.5

Tmax：最高血清中濃度到達時間、Cmax：最高速度血清中濃度

T<sub>1/2</sub>：生物学的半減期、AUC<sub>0-48</sub>：0～48時間の血清中濃度-時間曲線下面積

### 4. 結論

ロペラミド塩酸塩カプセル1mg「タイヨー」とロペミンカプセルは、経口投与後の未変化体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。