

リストールカプセル0.5の生物学的同等性試験

1. 試験目的

リストールカプセル0.5は、カルシトリオールを主薬とする活性型ビタミンD₃製剤である。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100mLと共に絶食単回経口投与

投与量：4カプセル(カルシトリオールとして2.0 μ g)

標準製剤：日本ロシュ(株)製造 ロカルトロールカプセル0.5

(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3年5月20日～平成3年9月30日

測定対象：血清中未変化体濃度(投与前の濃度を引いた補正值)

測定方法：ラジオレセプターアッセイ(RRA)

3. 試験結果

得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。(投与前の濃度を引いた補正值)

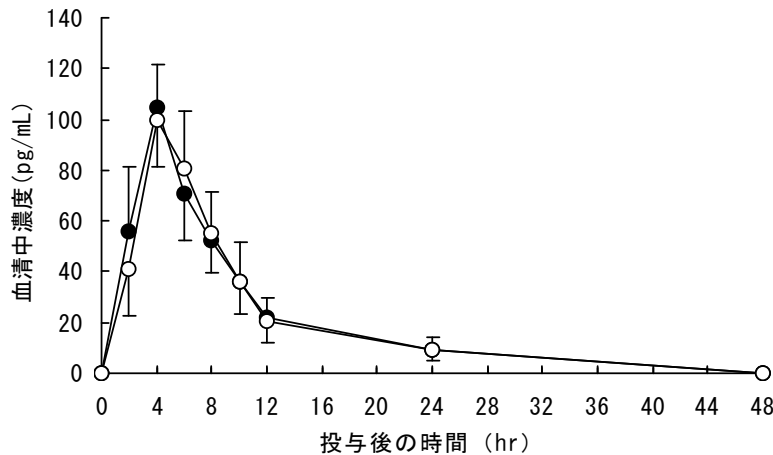


図1 平均血清中濃度推移

○：自社製剤、●：標準製剤、n=14、平均±標準偏差

表1 薬物動態パラメータ (n=14、平均±標準偏差)

| | 投与量 (μ g) | AUC ₀₋₄₈ (pg \cdot hr/mL) | C _{max} (pg/mL) | T _{max} (hr) | T _{1/2} (hr) |
|------|----------------|--|--------------------------|-----------------------|-----------------------|
| 自社製剤 | 2.0 | 931.4 \pm 183.8 | 105.6 \pm 14.1 | 4.3 \pm 0.7 | 7.3 \pm 2.1 |
| 標準製剤 | 2.0 | 963.9 \pm 220.9 | 104.5 \pm 16.9 | 4.0 \pm 0.0 | 7.7 \pm 2.1 |

AUC₀₋₄₈：0～48時間の血清中濃度－時間曲線下面積、C_{max}：最高血清中濃度

T_{max}：最高血清中濃度到達時間、T_{1/2}：消失半減期

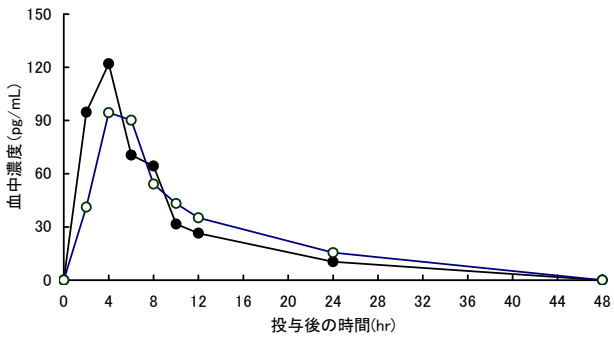
表2 同等性の判定結果

| 項目 | C _{max} | AUC ₀₋₄₈ |
|--------------------------|---------------------|---------------------|
| 母平均の比 | 1.01 | 0.97 |
| 90%信頼区間 | log(0.91)～log(1.13) | log(0.88)～log(1.08) |
| 判定基準 log(0.80)～log(1.25) | 適合 | 適合 |

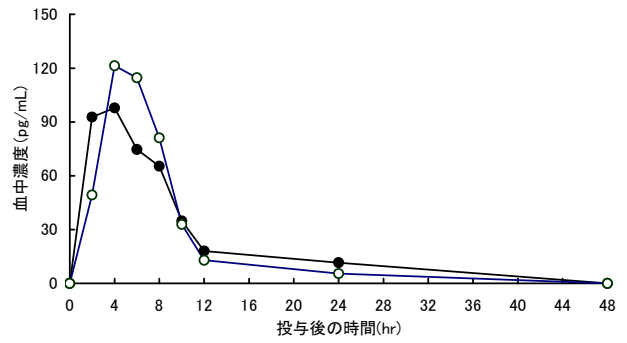
図2-1 各被験者の血清中濃度推移(投与前の濃度を引いた補正值)

○ : リストールカプセル0.5、● : ロカルトロールカプセル0.5

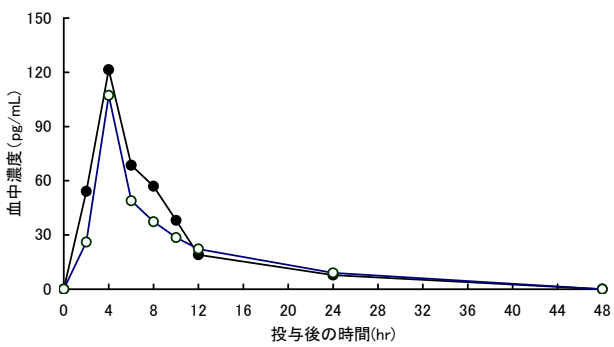
被験者番号 1



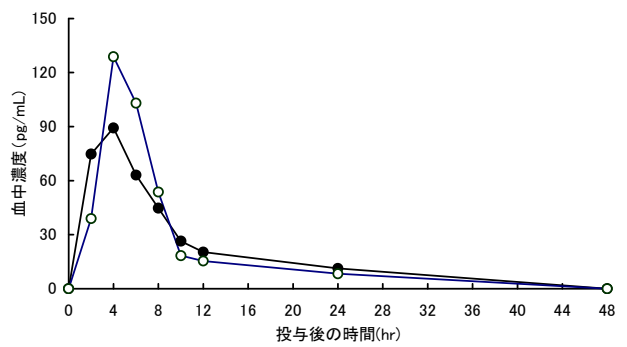
被験者番号 2



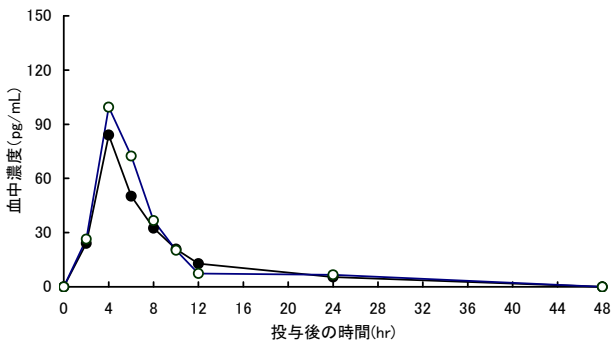
被験者番号 3



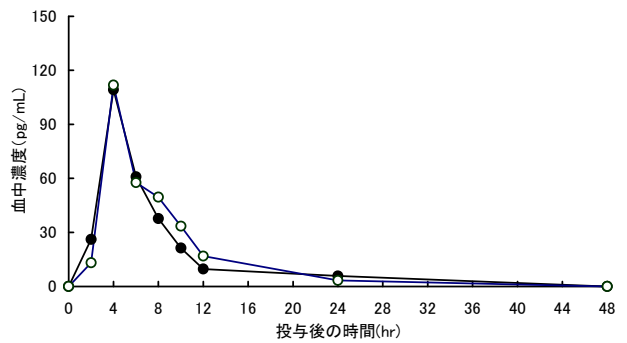
被験者番号 4



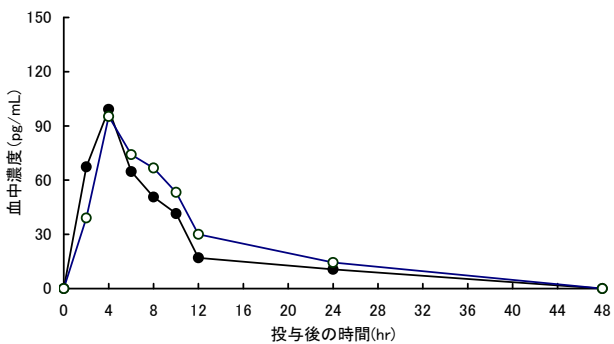
被験者番号 5



被験者番号 6



被験者番号 7



被験者番号 8

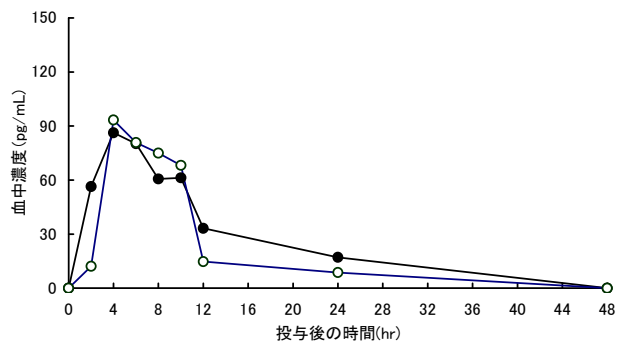
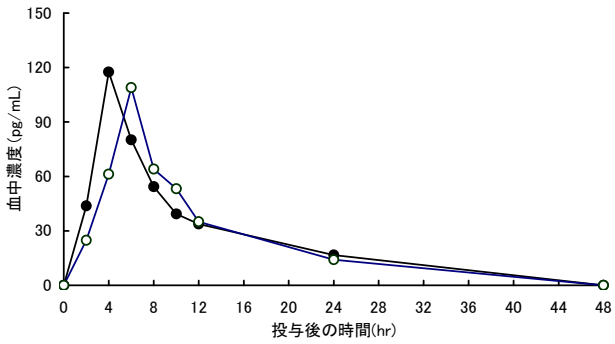


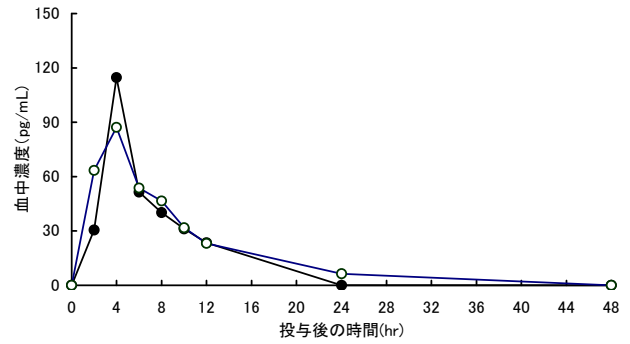
図2-2 各被験者の血清中濃度推移(投与前の濃度を引いた補正值)

○ : リストールカプセル0.5、● : ロカルトロールカプセル0.5

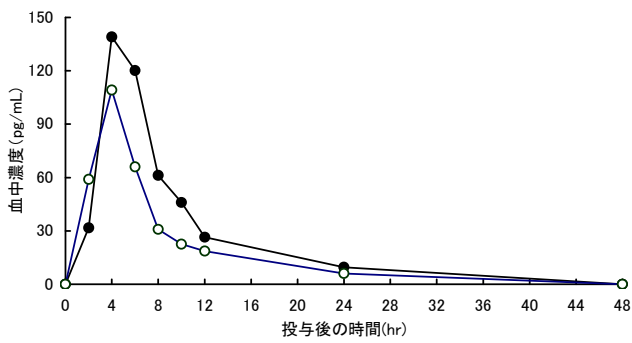
被験者番号 9



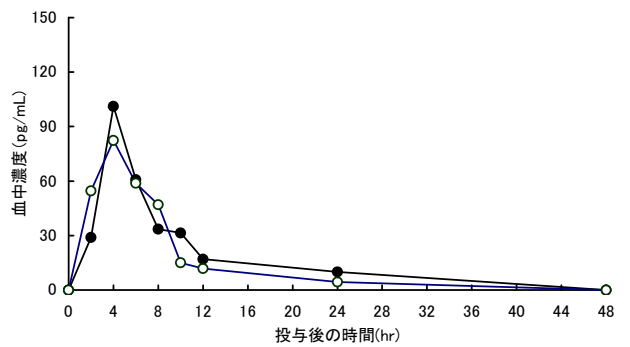
被験者番号 10



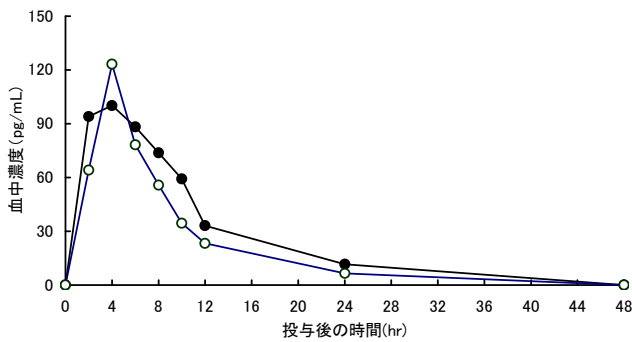
被験者番号 11



被験者番号 12



被験者番号 13



被験者番号 14

