

GnRH 誘導体制剤

ブセレリン点鼻液0.15%「ILS」

Buserelin Nasal Solution 0.15% 「ILS」

ブセレリン酢酸塩製剤

－ 生物学的同等性試験結果 －

ILS 株式会社

【 ブセレリン点鼻液 0.15% 「ILS」 の生物学的同等性試験結果 】

I. 治験薬

1. 被験薬： ブセレリン点鼻液 0.15% 「ILS」 点鼻用噴霧 1 瓶 (10mL) 中、ブセレリン酢酸塩^{注)}として 15.75mg (ブセレリンとして 15mg) を含有する点鼻液。
2. 標準製剤： 先発製剤
点鼻用噴霧 1 瓶 (10mL) 中、ブセレリン酢酸塩^{注)}として 15.75mg (ブセレリンとして 15mg) を含有する点鼻液。

(注) ブセレリン酢酸塩： 下記に示される視床下部ホルモン GnRH 誘導体である。

一般名： ブセレリン酢酸塩 (JAN)

化学名： 5-Oxo-L-prolyl-L-histidyl-L-tryptophyl-L-seryl-L-tyrosyl-*O*-*tert*-butyl-D-seryl-L-leucyl-L-arginyl-*N*-ethyl-L-prolinamide monoacetate (IUPAC)

分子式： $C_{60}H_{86}N_{16}O_{13} \cdot C_2H_4O_2$

分子量： 1299.48

II. 治験方法

ブセレリン点鼻液 0.15% 「ILS」 と標準製剤を各々被験者 (健康成人男子) 15 例に、2 剤 2 期のクロスオーバー法により絶食単回投与 (左右の鼻腔に 1 噴霧ずつブセレリンとして 300 μ g 投与) した。

被験者の年齢は 20~27 歳 (平均 22.3 歳) で、体重は 49.9~79.1kg (平均 63.3kg) であった。

III. 血清中濃度測定方法と解析

血清中濃度測定用採血は、投与前、投与後 10、20、30、45、60、90、120、240 及び 300 分の計 10 ポイントとした。

上記の各時間に 1 回 10mL を前腕部皮静脈より真空採血管で採血した。採血後は遮光し、室温にて 1 時間放置した後、4 $^{\circ}$ C、3,000rpm で 10 分間遠心分離し、血清は分析開始時まで -20 $^{\circ}$ C に凍結保存した。

血清中ブセレリン濃度の測定は EIA 法 (定量限界 6.25pg/mL) により、ILS 株式会社において実施した。

IV. 結果

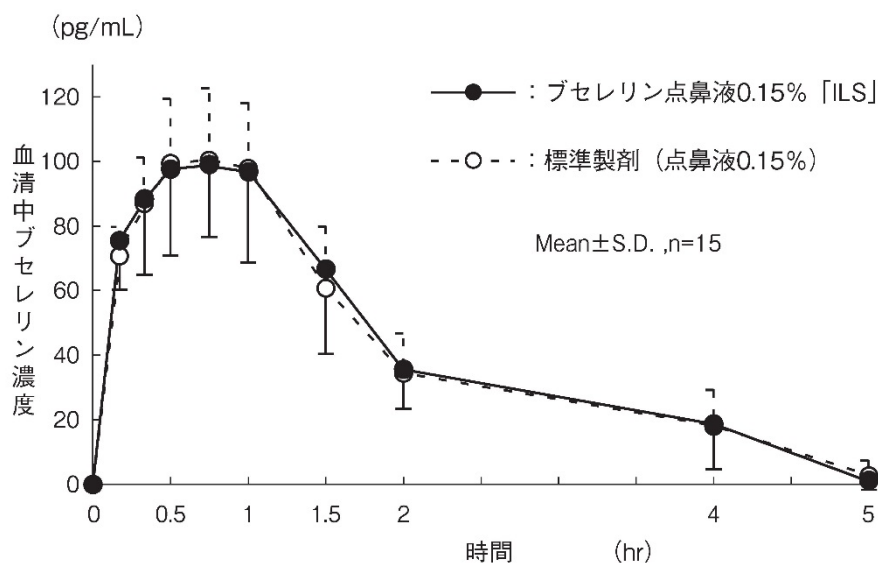
ブセレリン点鼻液 0.15% 「ILS」 と標準製剤を、それぞれ単回投与 (左右鼻腔内に 1 噴霧ずつブセレリンとして 300 μ g 投与：鼻腔経路による粘膜吸収) した時の血清中ブセレリン

濃度の推移は下図のとおりであった。

血清中濃度パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→5} (pg·hr/mL)	Cmax (pg/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ブセレリン 点鼻液 0.15% 「ILS」	214.66 ± 64.39	103.53 ± 23.77	0.83 ± 0.29	1.41 ± 0.88
標準製剤 (点鼻液 0.15%)	210.69 ± 40.27	105.78 ± 20.78	0.73 ± 0.27	1.45 ± 0.77

(Mean ± S.D., n=15)



血清中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

血清中ブセレリン濃度について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 (0.8) ~ 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。

以上

ILS 株式会社