

## エンテカビル錠0.5mg「JG」の生物学的同等性試験

### 1. 試験目的

エンテカビル錠0.5mg「JG」は、エンテカビル水和物を主薬とする抗ウイルス化学療法剤である。今回、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従い試験を実施し、標準製剤との同等性を検証した。

### 2. 試験方法

#### (1)被験者

健康成人男子

#### (2)投与・採血方法

試験製剤と標準製剤（錠剤、0.5mg）をクロスオーバー法により各1錠（エンテカビルとして0.5mg）水150mLとともに絶食単回経口投与した。投与前10時間以上と、投与後4時間まで絶食とし、投与前1時間から投与後4時間まで水分摂取も禁止とした。

投与前及び投与後0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6、8、10、12、24、74時間に採血を行い、遠心分離にて分離後、血漿を採取し測定検体とした。

#### (3)測定対象・方法

血漿中未変化体（エンテカビル）

液体クロマトグラフィー・タンデム質量分析法（LC-MS/MS法）

### 3. 試験結果

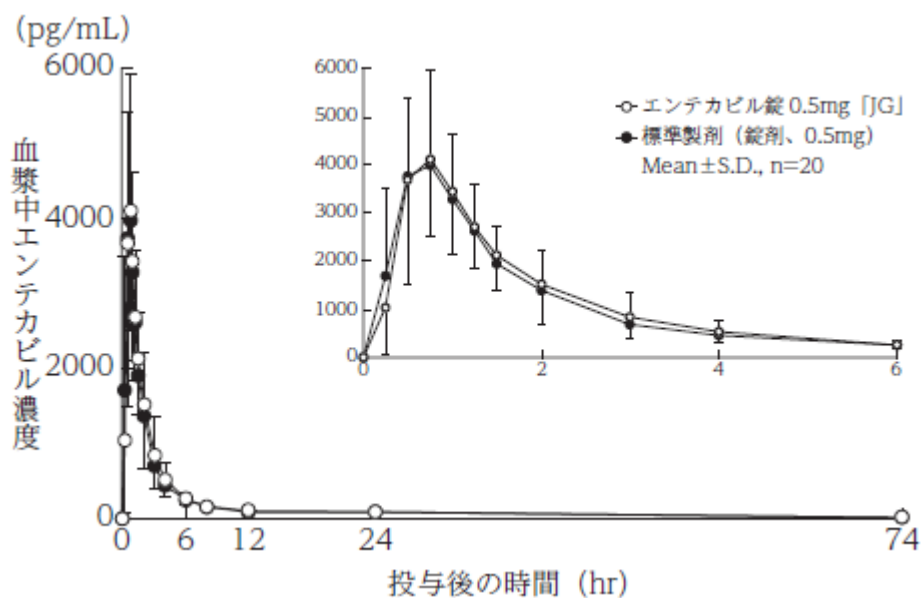


図 血漿中未変化体濃度推移

表1 薬物動態パラメータ (Mean±S.D., n=20)

|                  | 判定パラメータ                           |                             | 参考パラメータ                  |                          |
|------------------|-----------------------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|
|                  | AUC <sub>0-74</sub><br>(pg·hr/mL) | C <sub>max</sub><br>(pg/mL) | T <sub>max</sub><br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| エンテカビル錠0.5mg「JG」 | 12594.17±<br>2728.05              | 4710.2±<br>1520.0           | 0.8±0.4                  | 26.5±23.4                |
| 標準製剤(錠剤、0.5mg)   | 11901.08±<br>2077.25              | 4700.9±<br>1056.2           | 0.8±0.5                  | 29.8±27.3                |

AUC<sub>0-74</sub>: 0~74時間の血漿中濃度-時間曲線下面積、C<sub>max</sub>: 最高血漿中濃度、T<sub>max</sub>: 最高血漿中濃度到達時間、T<sub>1/2</sub>: 消失半減期  
 血漿中濃度並びにAUC、C<sub>max</sub>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。

表2 同等性の判定結果

|                                 | AUC <sub>0-74</sub>       | C <sub>max</sub>          |
|---------------------------------|---------------------------|---------------------------|
| 試験製剤と標準製剤の<br>対数値の平均値の差の90%信頼区間 | log(0.9794) ~ log(1.1262) | log(0.8824) ~ log(1.0866) |

#### 4. 結論

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従い試験を実施し、90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、両剤のAUC<sub>0-24</sub>及びC<sub>max</sub>の対数値の平均値の差の90%信頼区間はlog(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、エンテカビル錠0.5mg「JG」と標準製剤の生物学的同等性が確認された。

平成29年4月