

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「JG」の生物学的同等性試験

1.試験目的

レボセチリジン塩酸塩錠5mg「JG」は、レボセチリジン塩酸塩を主薬とする持続性選択H₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。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、生物学的同等性試験を実施した。試験製剤[レボセチリジン塩酸塩錠5mg「JG」]と標準製剤を健康成人男子に絶食単回経口投与後、血漿中未変化体濃度を測定し、統計学的手法により解析した結果を報告する。

2.試験方法

(1)被験者

健康成人男子 20 例

(2)投与・採血方法

試験製剤と標準製剤をクロスオーバー法により各 1 錠(レボセチリジン塩酸塩として 5mg)を水 150mL とともに絶食単回経口投与した。投与前 10 時間から投与後 4 時間は絶食とし、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 0.08、0.17、0.25、0.33、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6、12、24 及び 48 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

血漿中レボセチリジン

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 1 血漿中未変化体濃度推移

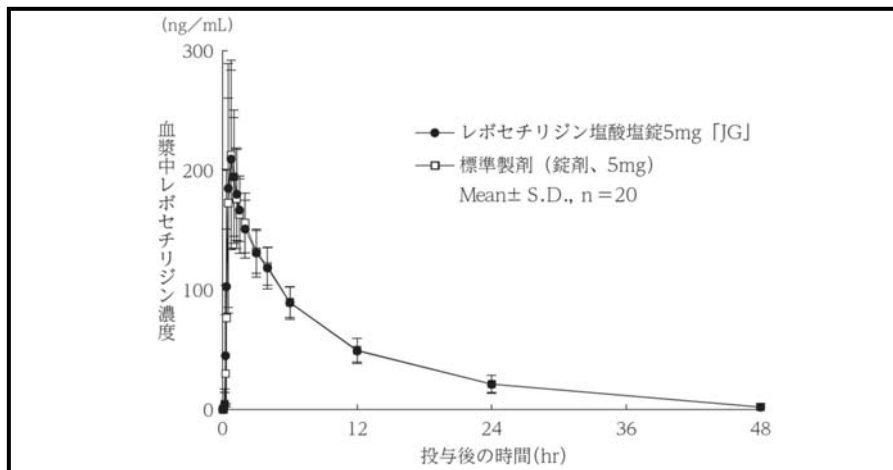


表 1 薬物動態パラメータ (Mean±S.D., n=20)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「JG」	1882.0±358.3	245.92±56.86	0.85±0.58	8.31±1.64
標準製剤(錠剤、5mg)	1895.4±346.4	245.96±49.65	0.93±0.52	8.44±1.42

AUC₀₋₄₈: 0~48 時間の血漿中濃度-時間曲線下面積、Cmax: 最高血漿中濃度、Tmax: 最高血漿中濃度到達時間、t_{1/2}: 消失半減期
血漿中濃度並びに 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。

表 2 同等性の判定結果

	AUC ₀₋₄₈	Cmax
90%信頼区間	log(0.9720) ~ log(1.0099)	log(0.8946) ~ log(1.1068)

4. 結論

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、90%信頼区間は表 2 に示す通り log(0.80) ~ log(1.25) の範囲内であり、試験製剤[レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「JG」]と標準製剤の生物学的同等性が確認された。

2020 年 3 月