

ロラタジンOD錠10mg「JG」の生物学的同等性試験

試験実施期間：平成22年5月8日～平成22年5月28日

1.試験目的

ロラタジンOD錠10mg「JG」は、ロラタジン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、本製剤の生物学的同等性試験を実施した。試験製剤と標準製剤を健康成人男子に絶食単回経口投与後、血漿中活性代謝物(DCL)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。

なお、本剤が口腔内崩壊錠であることにより、水あり及び水なしで服用時における試験を実施した。

2.試験方法

(1)被験者

健康成人男子を被験者とした。

(2)投与・採血方法

クロスオーバー法により、試験製剤と標準製剤を絶食単回経口投与した。所定の時間に採血を実施し、遠心分離にて分離後、血漿を採取し測定検体とした。

3.血漿中濃度測定結果

【水あり】

試験製剤と標準製剤を各1錠(ロラタジンとして10mg)、水150mLと共に絶食単回経口投与した後の血漿中活性代謝物濃度推移並びに薬物動態パラメータを図1及び表1に示す。

図1 水ありで服用時の血漿中活性代謝物濃度推移

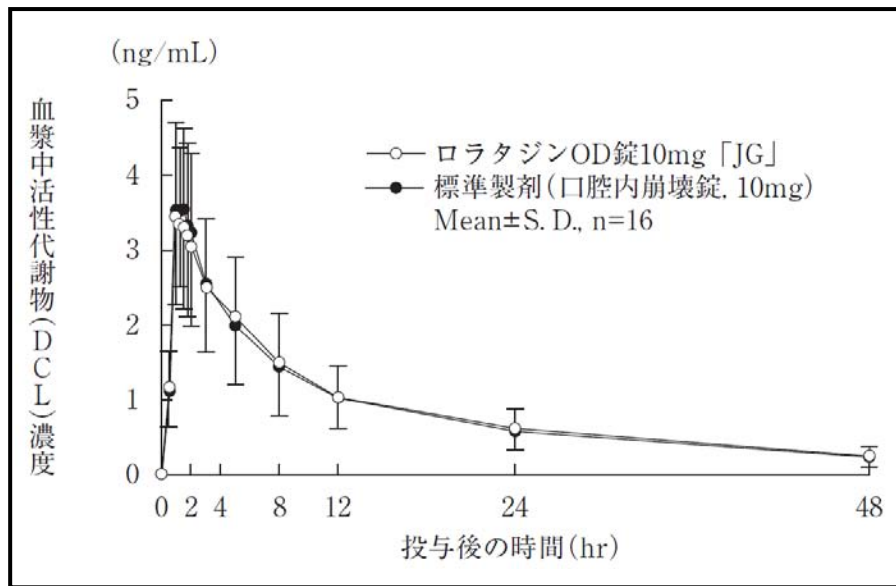


表1 パラメータ (Mean±S.D., n=16)

	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)
ロラタジンOD錠10mg「JG」	42.7±17.4	3.9±1.2	1.5±1.0	17.2±2.5
標準製剤 (口腔内崩壊錠, 10mg)	41.8±16.0	3.9±1.1	1.4±0.4	17.0±2.1

AUC₀₋₁₆₈: 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。

【水なし】

試験製剤と標準製剤を各1錠(ロラタジンとして10mg)、水なしで絶食単回経口投与した後の血漿中活性代謝物濃度推移並びに薬物動態パラメータを図2及び表2に示す。

図2 水なしで服用時の血漿中活性代謝物濃度推移

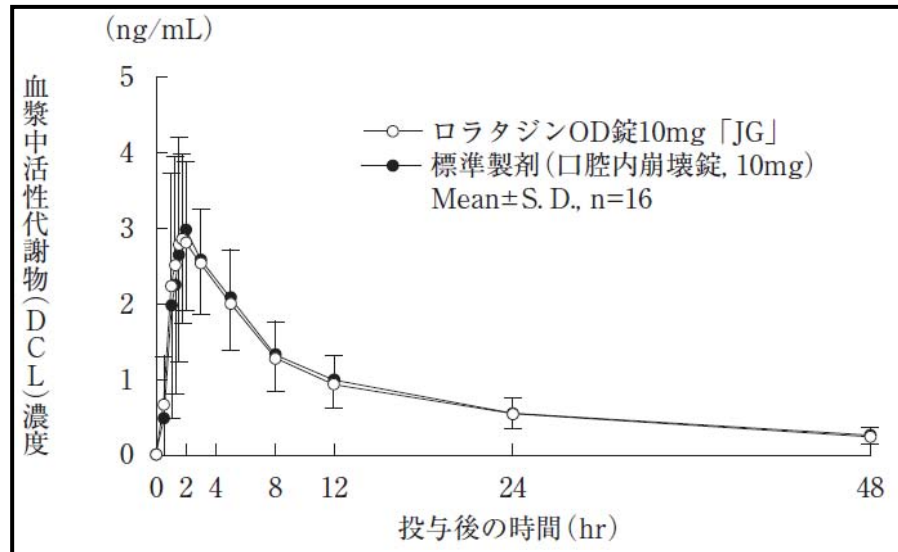


表2 パラメータ (Mean ± S.D., n=16)

	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)
ロラタジンOD錠10mg「JG」	38.4 ± 9.3	3.4 ± 0.9	2.0 ± 1.0	18.7 ± 3.0
標準製剤 (口腔内崩壊錠, 10mg)	39.6 ± 11.2	3.5 ± 1.0	2.1 ± 1.3	18.9 ± 2.7

AUC₀₋₁₆₈: 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。

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、水ありで服用および水なしで服用時ともに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。

平成23年9月