

## ナフトピジルOD錠75mg「JG」の生物学的同等性試験

### 1. 試験目的

ナフトピジルOD錠75mg「JG」は、ナフトピジルを主薬とする前立腺肥大症に伴う排尿障害改善剤である。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、フリバスOD錠75mgとの生物学的同等性を検証した。

### 2. 試験方法

#### (1) 被験者

健康成人男性

#### (2) 投与・採血方法

ナフトピジルOD錠75mg「JG」とフリバスOD錠75mgをクロスオーバー法によりそれぞれ1錠(ナフトピジルとして75mg)を絶食単回経口投与した。なお、口腔内崩壊錠のため「水で服用」と「水なしで服用」の2条件で実施した。

水で服用: 投与前10時間、投与後4時間は絶食とし、水150mLとともに服用させた。

水なしで服用: 投与前10時間は絶食、投与前後1時間は絶飲とし、投与後4時間までは絶食とする。水なしで舌の上で溶かし、唾液とともに服用させた。

投与前、投与後0.25、0.5、1、1.5、2、4、6、8、12及び24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

血漿中ナフトピジル

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  
(1) 水で服用

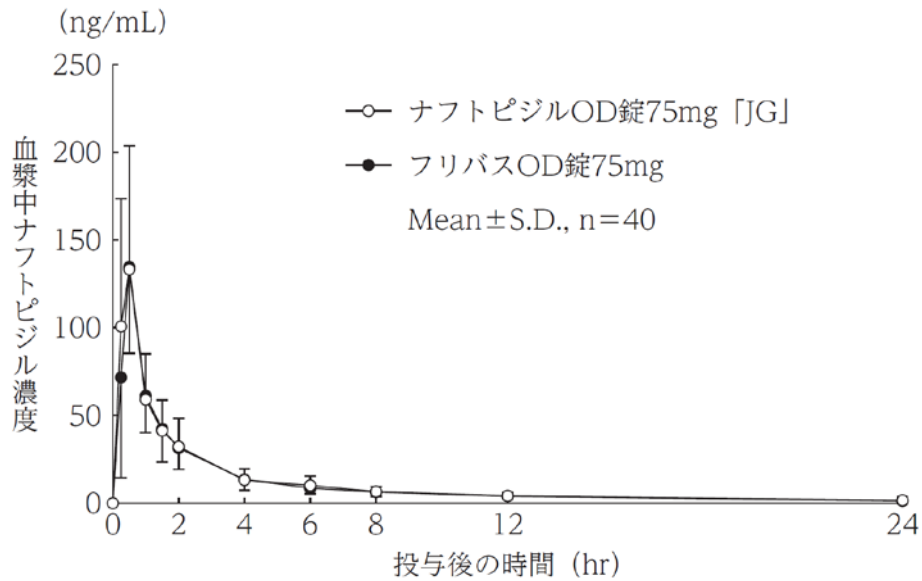


図1 血漿中ナフトピジル濃度推移

表1 薬物動態パラメータ (Mean ± S.D., n=40)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-24</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ナフトピジルOD錠75mg「JG」	275.6 ± 87.0	148.86 ± 56.60	0.5 ± 0.2	7.8 ± 5.6
フリバスOD錠75mg	263.0 ± 98.1	136.97 ± 68.53	0.5 ± 0.2	8.0 ± 5.3

AUC<sub>0-24</sub>: 0~24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

両剤の対数値	AUC <sub>0-24</sub>	C <sub>max</sub>
平均値の差	log(1.0622)	log(1.1079)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9791) ~ log(1.1525)	log(0.9704) ~ log(1.2650)

(2) 水なしで服用

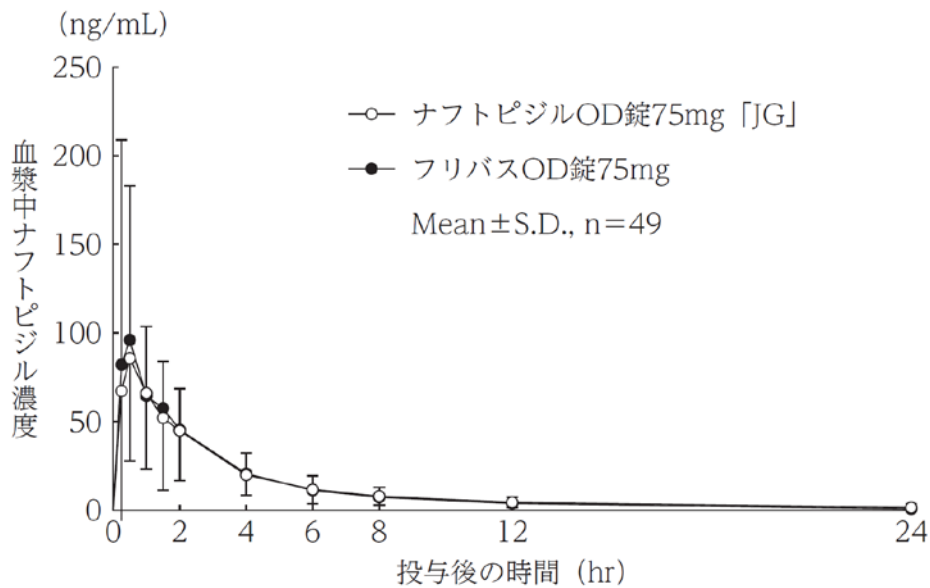


図2 血漿中ナフトピジル濃度推移

表3 薬物動態パラメータ (Mean ± S.D., n=49, フリバスOD錠75mgのT<sub>1/2</sub>はn=48)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-24</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ナフトピジルOD錠75mg「JG」	296.3 ± 139.6	113.58 ± 75.89	0.9 ± 0.8	6.4 ± 4.2
フリバスOD錠75mg	295.7 ± 138.4	132.56 ± 116.46	0.9 ± 0.9	5.7 ± 5.9

AUC<sub>0-24</sub>: 0~24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4 同等性の判定結果

両剤の対数値	AUC <sub>0-24</sub>	C <sub>max</sub>
平均値の差	log(0.9973)	log(0.9320)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9386) ~ log(1.0597)	log(0.8146) ~ log(1.0662)

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。水で服用した場合には両剤のAUC及びC<sub>max</sub>の対数値の平均値の差がlog(0.90)~log(1.11)の範囲内であり、かつ、溶出試験において溶出挙動が類似していることから、ナフトピジルOD錠75mg「JG」とフリバスOD錠75mgの生物学的同等性が確認された。また、水なしで服用した場合には両剤のAUC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、ナフトピジルOD錠75mg「JG」とフリバスOD錠75mgの生物学的同等性が確認された。

2023年10月

003