

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「JG」の生物学的同等性試験

1. 試験目的

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「JG」は、オロパタジン塩酸塩を主薬とするアレルギー性疾患治療剤(口腔内崩壊錠)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、アレロックOD錠5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

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「JG」とアレロックOD錠5をクロスオーバー法によりそれぞれ1錠(オロパタジン塩酸塩として5mg)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時間は絶食、投与前1時間から投与後4時間は絶飲食とし、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1時間から投与後4時間は絶飲食とし、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20、40分、1、1.5、2、3、4、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

血漿中オロパタジン

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
(1) 水で服用

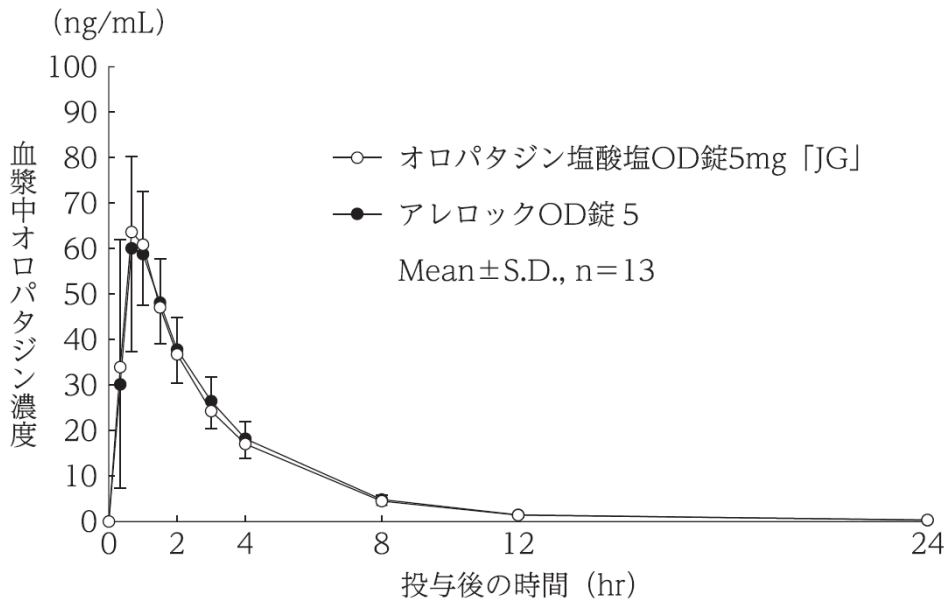


図1 血漿中オロパタジン濃度推移

表1 薬物動態パラメータ(Mean±S.D., n=13)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「JG」	206.73±27.26	69.20±12.57	0.7±0.2	3.6±0.7
アレロックOD錠5	211.75±25.98	67.46±11.87	0.9±0.3	3.1±0.4

AUC₀₋₂₄: 0~24時間の血漿中濃度-時間曲線下面積、C_{max}: 最高血漿中濃度、T_{max}: 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、C_{max}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 ₀₋₂₄	C _{max}
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9504) ~ log(0.9986)	log(0.9365) ~ log(1.1322)

(2) 水なしで服用

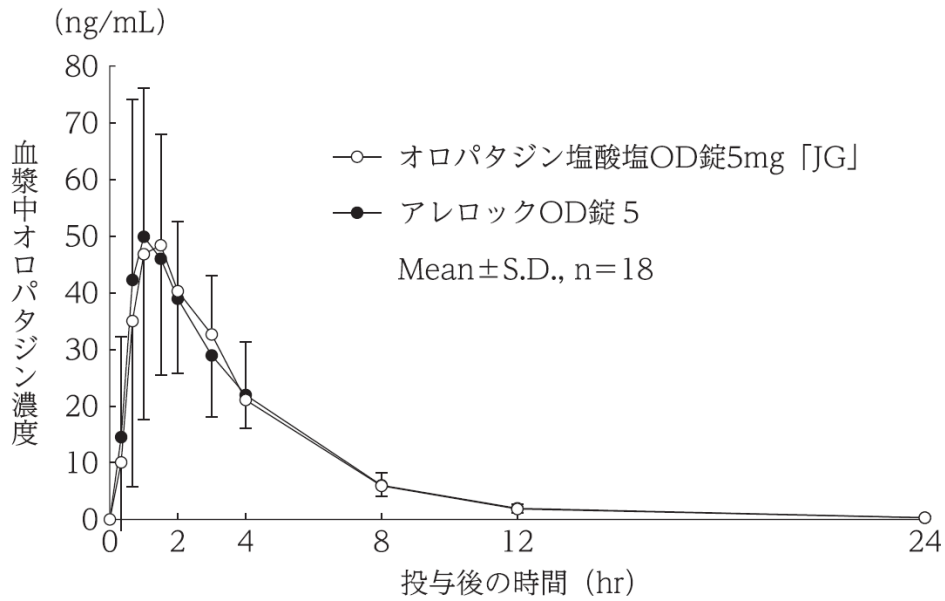


図2 血漿中オロパタジン濃度推移

表3 薬物動態パラメータ (Mean ± S.D., n = 18)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「JG」	214.37 ± 29.92	66.00 ± 18.21	1.5 ± 0.8	3.4 ± 0.6
アレロックOD錠5	217.22 ± 32.23	67.23 ± 16.60	1.4 ± 1.0	3.5 ± 0.6

AUC₀₋₂₄: 0~24時間の血漿中濃度-時間曲線下面積、C_{max}: 最高血漿中濃度、T_{max}: 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、C_{max}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 ₀₋₂₄	C _{max}
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9582) ~ log(1.0186)	log(0.8354) ~ log(1.1336)

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及びC_{max}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、オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「JG」とアレロックOD錠5の生物学的同等性が確認された。

2023年8月

003