

ピコスルファートナトリウム内用液**0.75%**「**JG**」の
生物学的同等性試験（薬力学的試験）に関する資料

ピコスルファートナトリウム水和物製剤『ピコスルファートナトリウム内用液0.75%「JG」』（長生堂製薬株式会社 製造販売）と標準製剤との生物学的同等性について薬力学的試験にて検討を行ったところ、以下のような結果を得た。

1. 方法

試験製剤：ピコスルファートナトリウム内用液0.75%「JG」（1mL中にピコスルファートナトリウム水和物7.5mg含有）

標準製剤：1mL中にピコスルファートナトリウム水和物7.5mg含有

被験動物：雄性ラット 50匹

割付け：＜瀉下作用試験＞ 1群 10匹の2群

＜硫酸バリウム排泄促進作用試験＞ 1群 10匹の3群

投与量：＜瀉下作用試験＞

試験製剤及び標準製剤それぞれピコスルファートナトリウム水和物として0.5, 1.0, 2.5, 5.0及び10.0mg/kg

＜硫酸バリウム排泄促進作用試験＞

試験製剤及び標準製剤それぞれピコスルファートナトリウム水和物として10.0及び25.0mg/kg（但し、無処置群には被験液を投与せず）

試験方法：＜瀉下作用試験＞

試験製剤及び標準製剤を経口投与し、投与後2時間毎に8時間まで下痢便排泄の有無を観察し、その全経過時間内瀉下効果発現率から50%瀉下有効量（ED₅₀）を比較した。

＜硫酸バリウム排泄促進作用試験＞

試験前24時間絶食させたラットに試験製剤及び標準製剤を投与した。治験薬投与から1時間後に50%硫酸バリウム懸濁液（1%アラビアゴム液を用いて懸濁）をラット1匹当たり2mL経口投与し、硫酸バリウムが糞便中に排泄されるまでの時間を測定した。また、両製剤を投与せず50%硫酸バリウム懸濁液のみを投与した無処置群の硫酸バリウム排泄時間を測定し、被験薬投与群及び無処置群の排泄時間より排泄促進率を求め、試験製剤と標準製剤の硫酸バリウム排泄促進作用を比較検討した。

2. 結果

試験製剤投与群及び標準製剤投与群の投与量別瀉下作用並びにED₅₀値を表1に、また、試験製剤投与群、標準製剤投与群及び無処置群の投与量別硫酸バリウム排泄時間及び排泄促進率を表2に表す。

1) 瀉下作用試験

試験製剤及び標準製剤投与群のED₅₀値は両製剤とも2.00mg/kgが得られ、両製剤間の瀉下作用に有意差は認められなかった。

2) 硫酸バリウム排泄促進作用試験

試験製剤及び標準製剤投与群の硫酸バリウム排泄時間は、無処置群と比較して大幅な時間短縮が認められ、また、試験製剤及び標準製剤投与群間の排泄時間に有意差は認められなかった。

3. 結論

本試験では、ピコスルファートナトリウム内用液0.75%「JG」及び標準製剤を投与し、両製剤の瀉下作用並びに硫酸バリウム排泄時間を測定した。その結果、両製剤の瀉下作用強度に有意差は認められなかった。また、両製剤投与群は無処置群と比較して明らかな硫酸バリウム排泄促進作用を示し、両製剤投与群間の比較においては、その作用強度に有意差は認められなかった。

よって、『ピコスルファートナトリウム内用液0.75%「JG」』（長生堂製薬株式会社 製造販売）と標準製剤とは生物学的に同等であると考えられ、両製剤投与後の治療効果も同等であることが推察された。

表1. 投与量別瀉下作用及びED₅₀値

| 被 験 薬 | 反応動物数／使用動物数 | | | | | ED ₅₀ 値 (mg/kg) |
|---------|---------------|------|------|------|-------|-------------------------------|
| | 投 与 量 (mg/kg) | | | | | |
| | 0.5 | 1.0 | 2.5 | 5.0 | 10.0 | |
| 試 験 製 剤 | 0/10 | 2/10 | 6/10 | 9/10 | 10/10 | 2.00 |
| 標 準 製 剤 | 0/10 | 1/10 | 7/10 | 9/10 | 10/10 | 2.00 |

表2. 投与量別硫酸バリウム排泄時間及び排泄促進率

| 群 | 試験製剤 | | 標準製剤 | | 無処置群 |
|---------------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 投 与 量 (mg/kg) | 10 | 25 | 10 | 25 | — |
| 排泄時間の平均値 (分) | 263.0 | 194.3 | 248.9 | 188.0 | 450.8 |
| 標 準 誤 差 | 10.7 | 6.2 | 10.3 | 6.5 | 14.5 |
| 排 泄 促 進 率 (%) | 41.7 | 56.9 | 44.8 | 58.3 | — |