

ロスバスタチンOD錠5mg「JG」の生物学的同等性試験

1. 試験目的

ロスバスタチンOD錠5mg「JG」は、HMG-CoA還元酵素阻害作用を有するロスバスタチンカルシウムを主薬とする脂質異常症治療剤である。今回、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従い試験を実施し、クレステール錠5mgとの同等性を検証した。

2. 試験方法

(1) 被験者

健康成人男性

(2) 投与・採血方法

ロスバスタチンOD錠5mg「JG」とクレステール錠5mgをクロスオーバー法により各1錠(ロスバスタチンとして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 : 10時間以上絶食後、水150mLとともに服用、投与前1時間から投与後4時間まで絶飲食とした。

水なしで服用 : 10時間以上絶食後、ロスバスタチンOD錠5mg「JG」は舌の上で溶かし唾液とともに服用、クレステール錠5mgは水150mLとともに服用、投与前1時間から投与後4時間まで絶飲食とした。

投与前及び投与後0.5、1、2、3、4、5、6、8、10、12、24、48、72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

血漿中ロスバスタチン

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

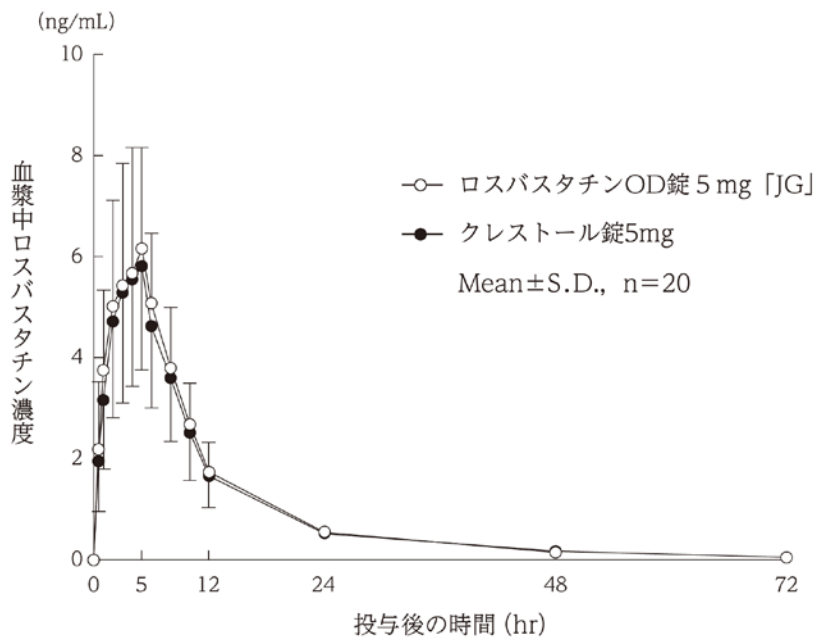


図1 血漿中ロスバスタチン濃度推移

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 ₀₋₇₂ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
ロスバスタチンOD錠5mg「JG」	72.76 ± 26.81	6.39 ± 2.34	4.60 ± 0.99	16.20 ± 10.18
クレストール錠5mg	69.42 ± 25.73	6.26 ± 2.51	4.10 ± 1.12	14.22 ± 3.84

AUC₀₋₇₂: 0~72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

	AUC ₀₋₇₂	C _{max}
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9943) ~ log(1.1336)	log(0.9475) ~ log(1.1241)

(2) 水なしで服用

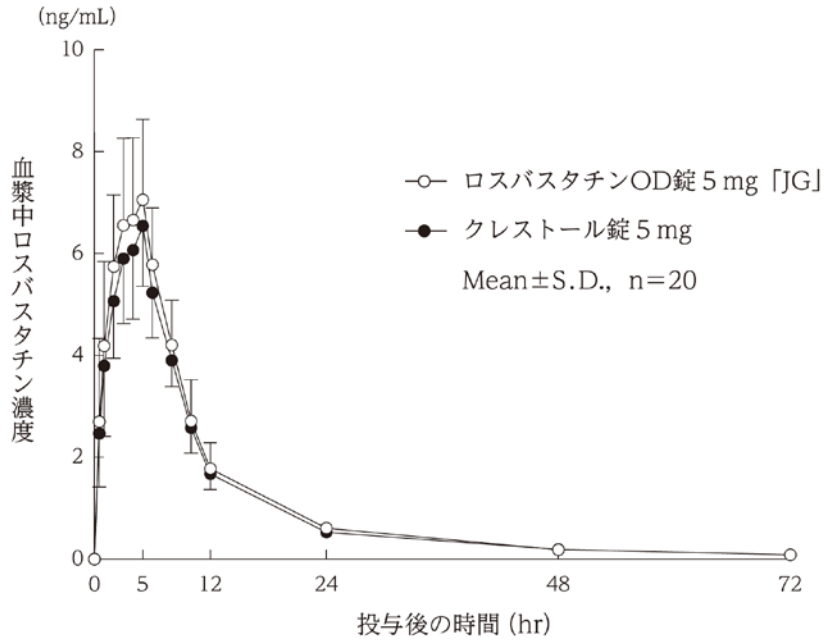


図2 血漿中ロスバスタチン濃度推移

表3 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 ₀₋₇₂ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
ロスバスタチンOD錠5mg「JG」	81.56 ± 17.09	7.28 ± 1.78	4.35 ± 1.09	14.37 ± 2.85
Crestor 錠5mg	75.31 ± 23.25	6.87 ± 2.23	4.40 ± 1.23	18.22 ± 6.46

AUC₀₋₇₂: 0~72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

	AUC ₀₋₇₂	C _{max}
平均値の差の90%信頼区間	log(1.0264) ~ log(1.2028)	log(0.9748) ~ log(1.1972)

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log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、ロスバスタチンOD錠5mg「JG」と Crestor 錠5mgの生物学的同等性が確認された。

2023年10月

002