

リナグリプチンOD錠5mg「JG」の生物学的同等性試験

1. 試験目的

リナグリプチンOD錠5mg「JG」は、胆汁排泄型選択的DPP-4阻害剤であるリナグリプチンを主薬とする2型糖尿病治療剤である。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、トラゼンタ錠5mg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

リナグリプチンOD錠5mg「JG」とトラゼンタ錠5mgをクロスオーバー法によりそれぞれ1錠(リナグリプチンとして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: 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、リナグリプチンOD錠5mg「JG」は水なしで舌の上で溶かし唾液とともに服用、トラゼンタ錠5mgは水150mLとともに服用させた。

投与前、投与後0.25、0.5、0.75、1、1.5、2、2.5、3、3.5、4、5、6、7、8、9、12、24、48及び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

血漿中リナグリプチン

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

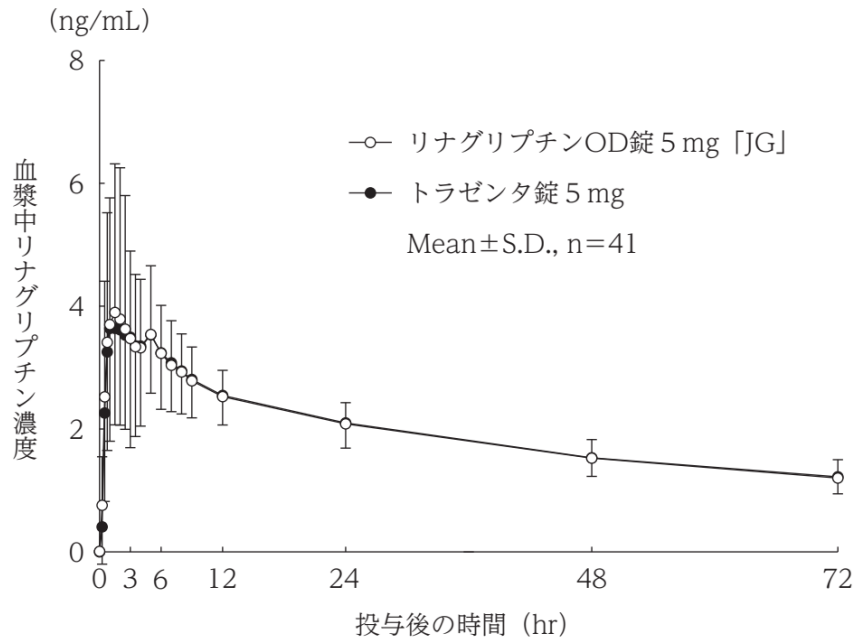


図1 血漿中リナグリプチン濃度推移

表1 薬物動態パラメータ(Mean ± S.D., n=41)

	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)
リナグリプチンOD錠 5mg「JG」	140.4 ± 26.8	4.6649 ± 2.7015	2.89 ± 2.22	60.67 ± 14.43
トラゼンタ錠5mg	140.9 ± 23.8	4.6972 ± 2.0145	2.76 ± 2.11	59.90 ± 17.71

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

両剤の対数値	AUC ₀₋₇₂	C _{max}
平均値の差	log(0.9930)	log(0.9635)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9551) ~ log(1.0323)	log(0.8600) ~ log(1.0795)

(2) 水なしで服用

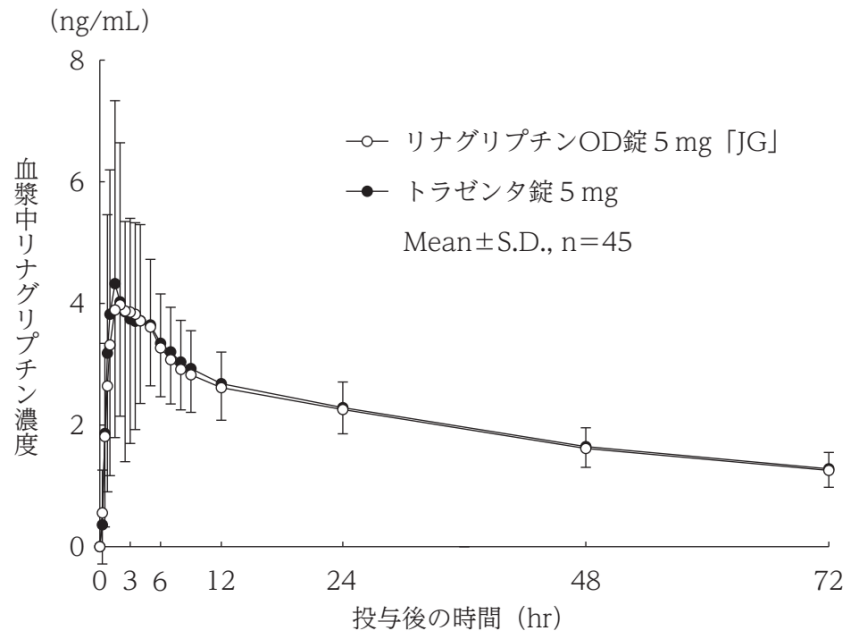


図2 血漿中リナグリプチン濃度推移

表3 薬物動態パラメータ (Mean ± S.D., n=45)

	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)
リナグリプチンOD錠 5mg「JG」	147.5 ± 27.7	4.8749 ± 2.1749	2.70 ± 1.73	57.44 ± 12.97
トラゼンタ錠5mg	150.6 ± 28.2	4.9340 ± 3.0078	2.83 ± 1.89	59.34 ± 15.06

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

両剤の対数値	AUC ₀₋₇₂	C _{max}
平均値の差	log(0.9786)	log(1.0157)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9468) ~ log(1.0115)	log(0.9029) ~ log(1.1425)

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、リナグリプチンOD錠5mg「JG」とトラゼンタ錠5mgの生物学的同等性が確認された。

2026年8月

001