

社内資料

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「BMD」
生物学的同等性に関する資料



品質保証部

1) 目的

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「BMD」と先発品（以下、標準製剤とする）との2製剤間の生物学的同等性を、血漿中オロパタジン未変化体の濃度を測定することにより検討した。

2) 使用薬剤

試験製剤 : オロパタジン塩酸塩錠 5mg「BMD」(Lot No. KEH - 3)

標準製剤 : 1錠中、オロパタジン塩酸塩 5mg 含有製剤

3) 実施時期

平成 21 年 11 月～平成 23 年 2 月（標準製剤の選定及び試験方法の検討期間を含む）

4) 被験者

健康な成人男子 18 名

年齢 : 20～31 歳 (平均 23 歳)

体重 : 50.4～78.6kg (平均 64.1kg)

5) 実施方法及び休薬期間

表 1 に従って、非盲検で実施。健康成人男子 18 名を無作為に各 9 名の 2 群（A・B 群）に分け、休薬期間を 7 日間とするクロスオーバー法により実施した。

表 1. 被験者の割り付け

群	被験者数	第 I 期 (単回経口投与)	休薬期間	第 II 期 (単回経口投与)
A 群	9 名	標準製剤 1 錠	7 日間	試験製剤 1 錠
B 群	9 名	試験製剤 1 錠	7 日間	標準製剤 1 錠

6) 投与条件及び投与量

試験製剤または標準製剤 1 錠（オロパタジン塩酸塩として 5mg）を投与前 10 時間以上絶食後の朝の空腹時に、150mL の水にて単回投与する。

7) 薬物濃度の測定

①採血時点 : 投与前、0.33、0.66、1、1.33、1.66、2、3、4、6、9、12、24 時間後の 13 時点

②採血量 : 全血 5mL（血漿として 1mL 以上）

③測定 : LC - MS/MS により、血漿中のオロパタジン未変化体濃度を測定

8) 評価項目

血漿中のオロパタジン未変化体濃度をもとに、 AUC_{0-24} 、 C_{max} の薬物動態パラメータを算出し、2 製剤間の生物学的同等性を検証した。

9) 試験結果

平均血漿中濃度を示したグラフを図、薬物動態 判定パラメータを表2に示した。

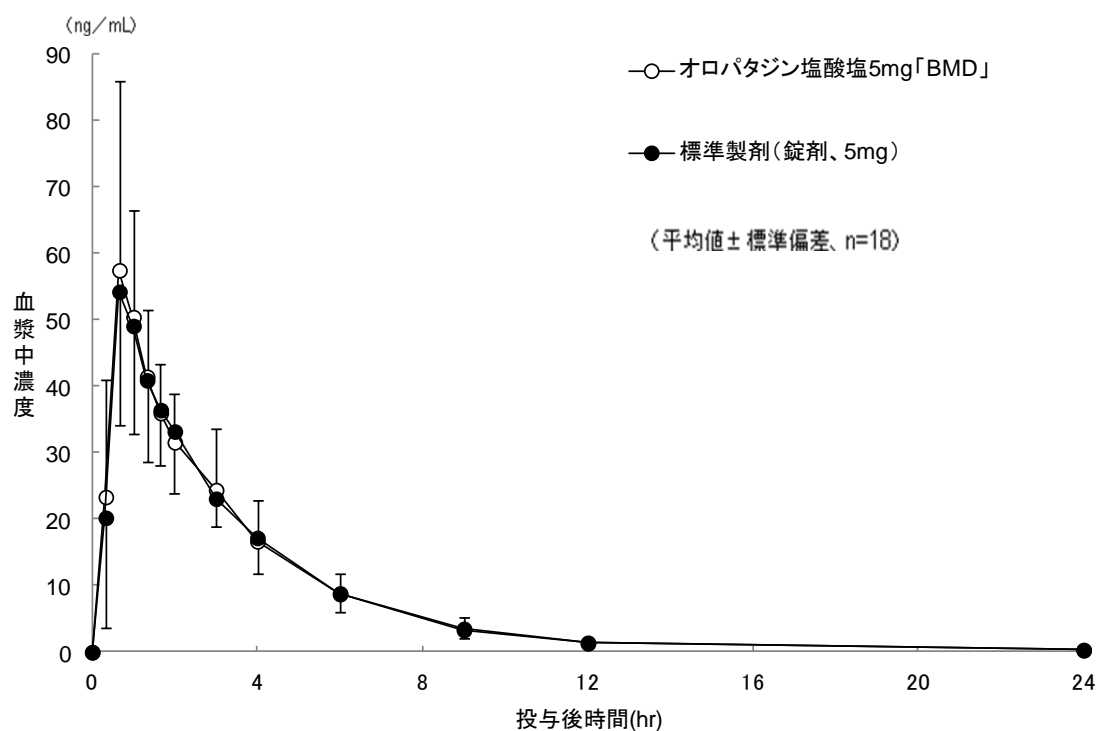


図. 平均血漿中濃度推移

表2. 薬物動態 判定パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸錠 5mg「BMD」	185.5±33.2	65.20±18.73	1.1±0.8	3.1±0.3
標準製剤 (錠剤、5mg)	181.7±29.7	59.63±13.29	1.1±0.8	3.0±0.2

(平均値±標準偏差 n=18)

10) 結論

AUC₀₋₂₄ 及び Cmax の対数変換値の平均値の差の90%信頼区間は log(0.80)~log(1.25)の範囲内となり、両製剤は AUC₀₋₂₄ 及び Cmax において同等であると判断された。

以上の結果より、両製剤は生物学的に同等であると判断された。