

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「ZE」の生物学的同等性試験に関する資料

ニプロ株式会社

<<社内資料>>

1. 被験薬剤

試験製剤：オロパタジン塩酸塩錠 5mg「ZE」

標準製剤：錠剤 5mg

[両薬剤とも1錠中に、オロパタジン塩酸塩(OLOT)として5mgを含有する。]

2. 被験者及び薬剤投与方法

健康成人男子18名を2群(I群9名、II群9名)に分け、クロスオーバー法に従い試験製剤及び標準製剤を絶食条件下でそれぞれ1錠(OLOTとして5mg)水とともに経口投与した。

3. オロパタジンの血漿中濃度測定

前腕皮静脈より採血し遠心分離より得た血漿について、オロパタジンをLC/MS/MS-MRM法により測定した。

4. 測定結果

薬剤投与後のオロパタジン(未変化体)の薬物動態パラメータAUC、Cmax、Tmax及び $t_{1/2}$ の平均値を表1に、平均血漿中未変化体濃度推移を図1に示した。また、両製剤のCmax及びAUC<sub>(0→24)</sub>対数変換値の平均値の差の90%信頼区間を表2に示した。

表1 薬物動態パラメータ (平均値±標準偏差、n=18)

	AUC <sub>(0→24)</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
試験製剤	185.5±33.2	65.2±18.7	1.1±0.8	3.1±0.3
標準製剤	181.7±29.7	59.6±13.3	1.1±0.8	3.0±0.2

表2 標準製剤と試験製剤の平均値の差の90%信頼区間

パラメータ	対数変換値の平均値の差の90%信頼区間
Cmax	log(0.98)~log(1.19)
AUC <sub>(0→24)</sub>	log(1.00)~log(1.04)

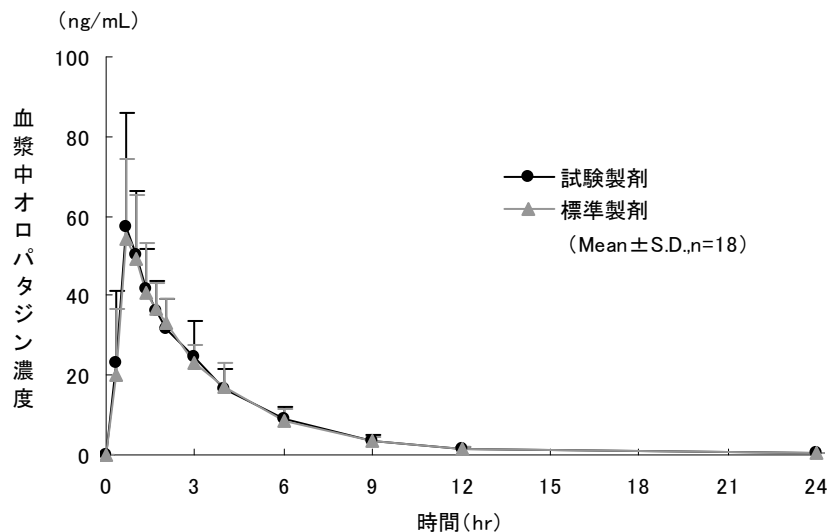


図1 薬剤投与後の平均血漿中濃度推移

## 5. 結論

上記の結果を「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(医薬審発第 487 号 平成 9 年 12 月 22 日、薬食審査発第 1124004 号一部改正 平成 18 年 11 月 24 日)」に従い評価したところ、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「ZE」と標準製剤は絶食単回経口投与において薬物動態パラメータ  $C_{max}$  及び  $AUC_{(0-24)}$  の対数変換値の平均値の差の 90%信頼区間が判定基準範囲内 ( $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ ) であることより、生物学的に同等であると判定した。