

ビカルタミド錠 80mg「オーハラ」の 生物学的同等性試験について

薬物動態に関する資料

大原薬品工業株式会社

ビカルタミド錠 80mg 「オーハラ」の生物学的同等性について

【要約】

日本人健康男子を対象として、ビカルタミド錠 80mg 「オーハラ」（大原薬品工業株式会社）と標準製剤（錠剤、80mg）との体内薬物動態による生物学的同等性を 2 剤 2 期のクロスオーバー法により試験した。その結果、指標としたビカルタミド錠 80mg 「オーハラ」と標準製剤との血漿中 R 体ビカルタミド濃度の AUC_{0-672} 及び C_{max} はガイドライン*の判定基準に適合し、両製剤は生物学的に同等であると判定された。

*：後発医薬品の生物学的同等性ガイドライン（平成 13 年 5 月 31 日 医薬審 786 号）

【試験材料及び試験方法】

1. 投与量

ビカルタミド錠 80mg 「オーハラ」及び標準製剤のそれぞれ 1 錠（ビカルタミドとして 80mg）を絶食下、単回投与した。

2. 採血ポイント

治験薬投与前、投与後 1、3、6、10、14、18、24、48、96、168、336、504 及び 672 時間

3. 治験薬

	被験薬	対照薬
名称	ビカルタミド錠 80mg 「オーハラ」	標準製剤 (錠剤、80mg)
Lot No.	B T 0 7	
剤形	白色の円形の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコート錠
成分・含有量	1 錠中ビカルタミド 80mg を含有	
製造会社	大原薬品工業株式会社	

4. 被検者

日本人健康成人男子 22 例

5. 試験方法

絶食下、被験者 22 例を無作為に 1 群 11 例の 2 群に割り付けた。被験者にビカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤のそれぞれ 1 錠（いずれもビカルタミドとして 80mg）を単回経口投与する 2 剤 2 期のクロスオーバー法により試験した。

6. 評価項目及び定量法

生物学的同等性は血漿中 R 体ビカルタミド濃度の AUC 及び C_{max} で評価し、定量は LC/MS/MS 法により行った。

【試験結果及び考察】

1. 血漿中 R 体ビカルタミド濃度の推移

ビカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤投与後の血漿中 R 体ビカルタミド濃度はほぼ同様の推移を示した（図 1）。

ビカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤の平均の AUC₀₋₆₇₂、C_{max}、t_{max}、t_{1/2} は、表 1 に示すようにほぼ一致した。

ビカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤の AUC₀₋₆₇₂、C_{max} に対する対数値の差の 90%信頼区間はそれぞれ、0.8995 ~ 1.0268、0.9333 ~ 1.0321 であり生物学的同等性の判定基準 log(0.8 ~ 1.25) を満たしていた。

以上の結果から、ビカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

表 1 ビカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤投与後の薬物動態パラメータ

治験薬	AUC ₀₋₆₇₂ (µg·hr/mL)	C _{max} (µg/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ビカルタミド錠 80mg 「オーハラ」	238.41 ± 49.33	1.17 ± 0.18	32.7 ± 16.3	111.3 ± 25.9
標準製剤 (錠剤、80mg)	247.57 ± 48.41	1.19 ± 0.17	33.0 ± 20.6	112.6 ± 22.9

各値は Mean ± S.D.

(n = 22)

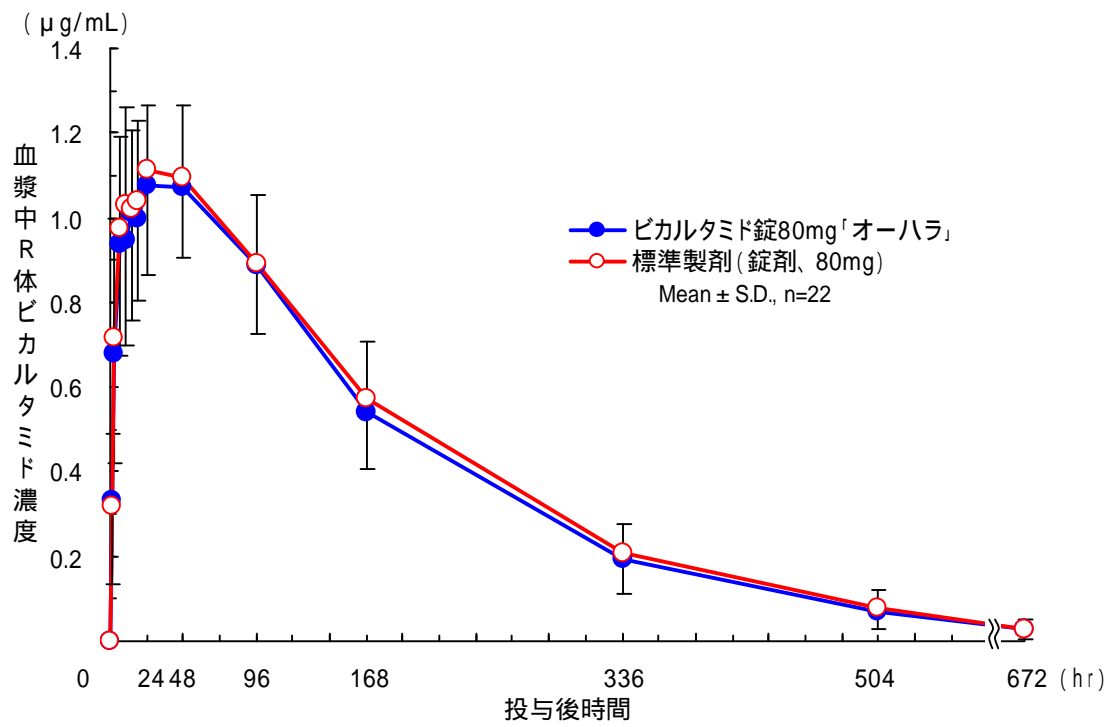


図1 ピカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤投与後の血漿中R体ピカルタミド濃度推移

(参考資料)

R体と同時に測定した血漿中S体ピカルタミド濃度を図2、また薬物動態パラメータを表2に示した。

ピカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤の血漿中S体ピカルタミド濃度はほぼ同様の推移を示し、また薬物動態パラメータについてもほぼ一致した。また、両剤の AUC_{0-672} 、 C_{max} に対する対数値の差の90%信頼区間はそれぞれ、0.9066~1.0821、0.8471~0.9800であり、判定基準 $\log(0.8 \sim 1.25)$ を満たしており、両剤の生物学的同等性が確認された。

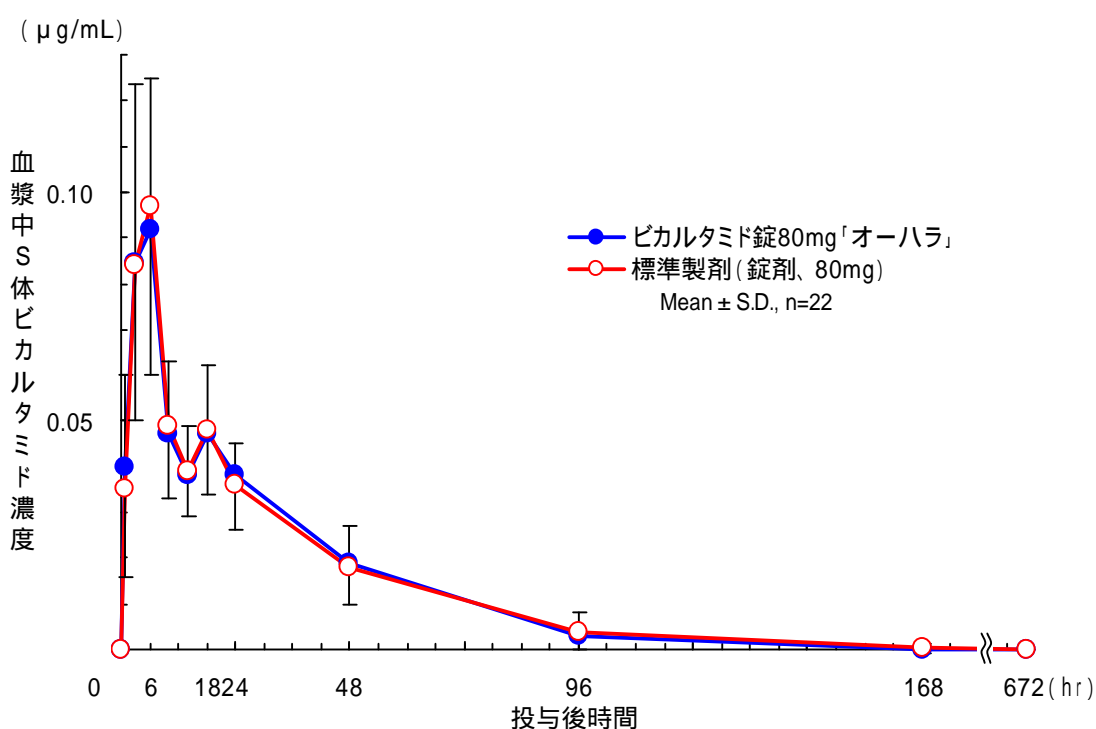


図2 ピカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤投与後の血漿中S体ピカルタミド濃度推移

表2 ピカルタミド錠 80mg「オーハラ」及び標準製剤投与後の薬物動態パラメータ

治験薬	AUC_{0-672} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)	C_{max} ($\mu\text{g/mL}$)	t_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ピカルタミド錠 80mg 「オーハラ」	2.61 ± 0.62	0.10 ± 0.04	4.8 ± 1.9	21.3 ± 10.0
標準製剤 (錠剤、80mg)	2.64 ± 0.68	0.10 ± 0.03	4.8 ± 1.5	23.7 ± 22.9

各値は Mean \pm S.D.

(n = 22)