

エゼチミブ錠 10mg「フェルゼン」 生物学的同等性に関する資料

エゼチミブ錠 10mg「フェルゼン」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（エゼチミブとして 10mg）を健康成人男性に絶食時単回経口投与して、血漿中エゼチミブ抱合体およびエゼチミブ非抱合体の濃度を測定した。

得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）を 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、ともに $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であったことから、両製剤は生物学的に同等であることが示された。

被験者 健康成人男性 20 名

試験薬剤 試験製剤：エゼチミブ錠 10mg「フェルゼン」
標準製剤：エゼチミブ錠、10mg/錠

試験方法 2 剤 2 期 クロスオーバー法
10 時間以上の絶食下で 150mL の水にて試験製剤、標準品（ともに 1 錠）を単回経口投与した。投与後 4 時間 15 分までは絶食とし、投与前 1 時間から投与後 4 時間 15 分までは飲水も禁止した。

採血 投与前、投与後 0.25、0.5、0.75、1、1.5、2、3、4、5、6、7、8、10、12、24、36、48、72 時間（計 19 時点）

試験結果

1) 血漿中エゼチミブ抱合体

試験製剤および標準品投与後の血漿中エゼチミブ抱合体濃度を図 1 に示した。

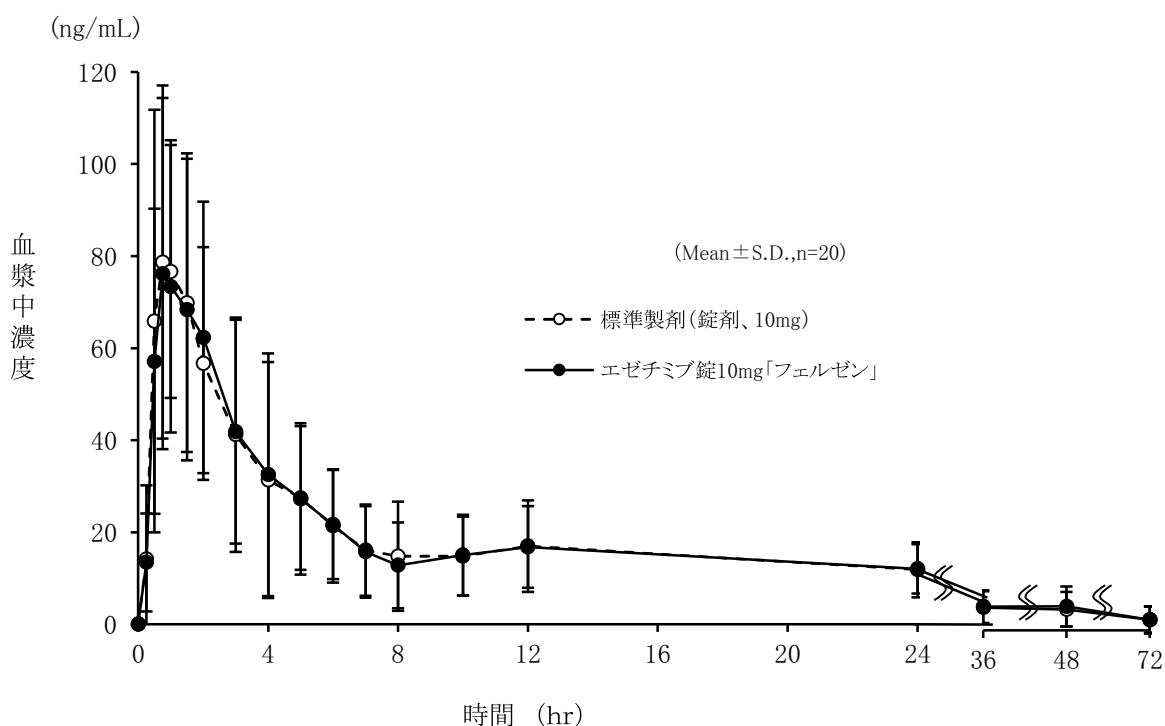
試験製剤および標準品の薬物動態パラメータの対数値の平均の差の 90%信頼区間は AUCt で $\log(0.9659) \sim \log(1.0995)$ 、Cmax で $\log(0.8372) \sim \log(1.0575)$ であり、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であったことから、両製剤は生物学的に同等であると判定された。

2) 血漿中エゼチミブ非抱合体

試験製剤および標準品投与後の血漿中エゼチミブ非抱合体濃度を図2に示した。

試験製剤および標準品の薬物動態パラメータの対数値の平均の差の90%信頼区間はAUCtで $\log(1.0087) \sim \log(1.1550)$ 、Cmaxでは $\log(0.8740) \sim \log(1.1747)$ であり、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であったことから、両製剤は生物学的に同等であると判定された。

【図1】 血漿中エゼチミブ（抱合体）濃度の推移



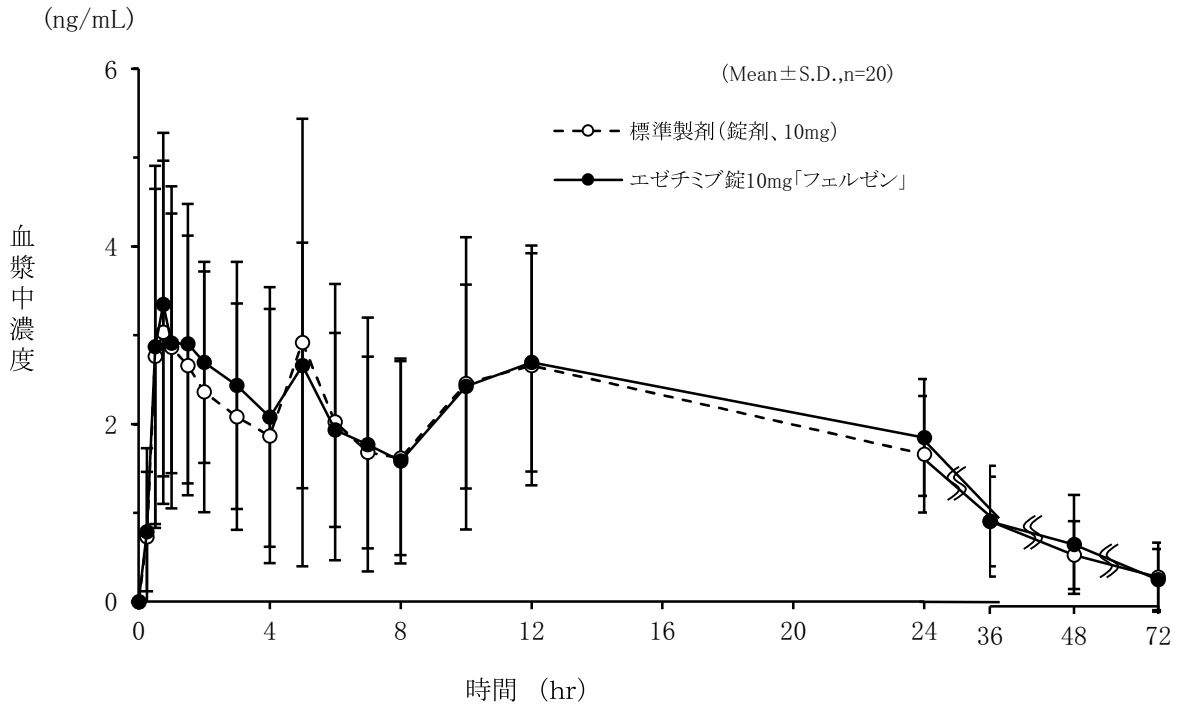
薬物動態パラメータ

(平均値±SD, n=20)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エゼチミブ錠 10mg 「フェルゼン」	761.7 ± 335.4	94.6 ± 38.2	1.2 ± 0.8	26.7 ± 24.4
標準製剤	750.1 ± 348.4	98.1 ± 33.6	1.3 ± 0.9	23.8 ± 11.7

パラメータ	AUC	Cmax	判定基準
90%信頼区間	0.9659~1.0995	0.8372~1.0575	0.80~1.25

【図2】 血漿中エゼチミブ（非抱合体）濃度の推移



薬物動態パラメータ

(平均値 ± SD, n=20)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エゼチミブ錠 10mg 「フェルゼン」	90.7 ± 30.9	4.8 ± 1.6	3.0 ± 3.2	22.4 ± 17.4
標準製剤	85.9 ± 35.3	4.9 ± 2.2	5.0 ± 4.5	22.1 ± 11.6

パラメータ	AUC	Cmax	判定基準
90%信頼区間	1.0087 ~ 1.1550	0.8740 ~ 1.1747	0.80 ~ 1.25