

生物学的同等性に関する資料

1. オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「フェルゼン」

試験方法 試験ガイドライン 含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成12年2月14日付 医薬審64号、平成18年11月24日一部改正）

標準製剤 オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「フェルゼン」

ロット番号 1406103

実施方法 溶出試験法第2法（パドル法） 試験液：水 回転数：50rpm 試験液量：900mL

試験結果 上記ガイドラインに基づき、試験製剤（オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「フェルゼン」）とヒトにおける先発品との生物学的同等性が確認されている標準製剤との溶出挙動を検討した。その結果、試験製剤と標準製剤の溶出挙動は同等と判定され、両製剤は生物学的に同等と判断された。なお、試験製剤の処方変更水準は、A水準に該当した。

【溶出挙動の比較】

- 平均溶出率の比較 ※判定基準 試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、または15分以内における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 10\%$ の範囲にある。

判定時間 (分)	試験製剤の溶出率 (%)			標準製剤の溶出率 (%)			平均溶出率 の差 (%)	判定
	平均値	最小値	最大値	平均値	最小値	最大値		
15	101.0	99.2	102.5	102.2	101.5	103.1	-1.2	適合

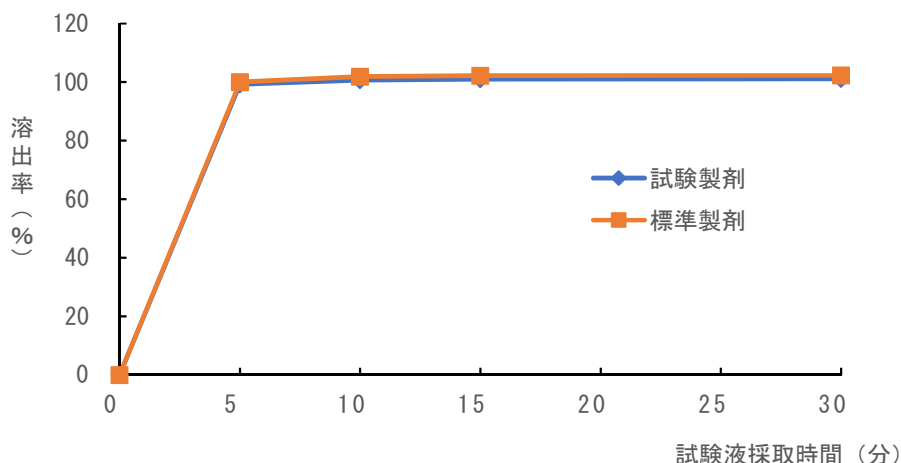
(n=12)

- 試験製剤の個々の溶出率

※判定基準 最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率において、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ を超えるものがない。

判定時間 (分)	試験製剤の溶出率 (%)			$\pm 15\%$ を 超える 個数	$\pm 25\%$ を 超える 個数	判定
	平均値	最小値～最大値	平均値 $\pm 15\%$			
15	101.0	99.2～102.5	86.0～116.0	0	0	適合

(n=12)



2. オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「フェルゼン」

試験方法 試験ガイドライン 後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 9 年 12 月 22 日付 医薬審第 487 号、平成 18 年 11 月 24 日一部改正）

標準製剤	オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg
被験者	健康成人男子 19 名
投与方法	クロスオーバー法による絶食単回経口投与
投与量	1錠（オロパタジン塩酸塩として 5mg）
測定対象	血漿中未変化体
測定法	液体クロマトグラフィー／タンデムマススペクトロメトリー（LC/MS/MS）
判定法	判定パラメータ C _{max} 及び AUC
	統計解析 90%信頼区間法

試験結果 試験製剤と標準製剤を「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に準じて試験を実施した。血漿中オロパタジン塩酸塩活性代謝物につき統計解析を行った結果、C_{max} 及び AUC の対数値の平均値の差の 90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準である log(0.80)～log(1.25)の範囲内であった。

以上のことから、両製剤は生物学的に同等であると判定された。

【生物学的利用率のパラメータ】

(平均値±標準偏差)

製品名		判定パラメータ		参考パラメータ	
		C _{max} (ng/mL)	AUC (ng·hr/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「フェルゼン」	水あり	76.85±19.03	253.41±48.30	0.8±0.4	9.96±7.74
	水なし	72.77±15.54	255.57±44.36	1.5±0.8	11.03±9.19
標準製剤（錠剤、5mg）	水あり	69.04±14.05	237.14±41.17	0.7±0.3	11.45±8.70
	水なし	64.91±15.72	245.78±43.68	1.8±0.7	10.55±6.48

【統計解析】

判定パラメータ		C _{max}	AUC	判定基準
90%信頼区間	水あり	1.0059～1.2124	0.9878～1.1499	
	水なし	1.0332～1.2366	0.9966～1.0858	

【平均血漿中未変化体濃度の推移】

