

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg / 5mg 「フェルゼン」

生物学的同等性に関する資料

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「フェルゼン」およびオロパタジン塩酸塩錠 5mg 「フェルゼン」を試験製剤とし、また、アレロック錠 2.5 およびアレロック錠 5 を標準製剤として「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（薬食審査発第 11240 04 号：平成 18 年 11 月 24 日）」に基づき検討した結果、両規格ともに 生物学的同等性が確認された。

試験方法

健康成人男性 18 名を無作為に 1 群 9 例の 2 群に割り付け、試験製剤と標準製剤のそれぞれ 1 錠を絶食単回経口投与し、7 日間の休薬期間を設けた 2 群 2 期クロスオーバー法における両製剤の血漿中オロパタジン濃度を測定した。（採血：投与前、投与後 0.25、0.5、1、2、3、4、5、6、8、12、24、36、48 時間の計 15 時点）

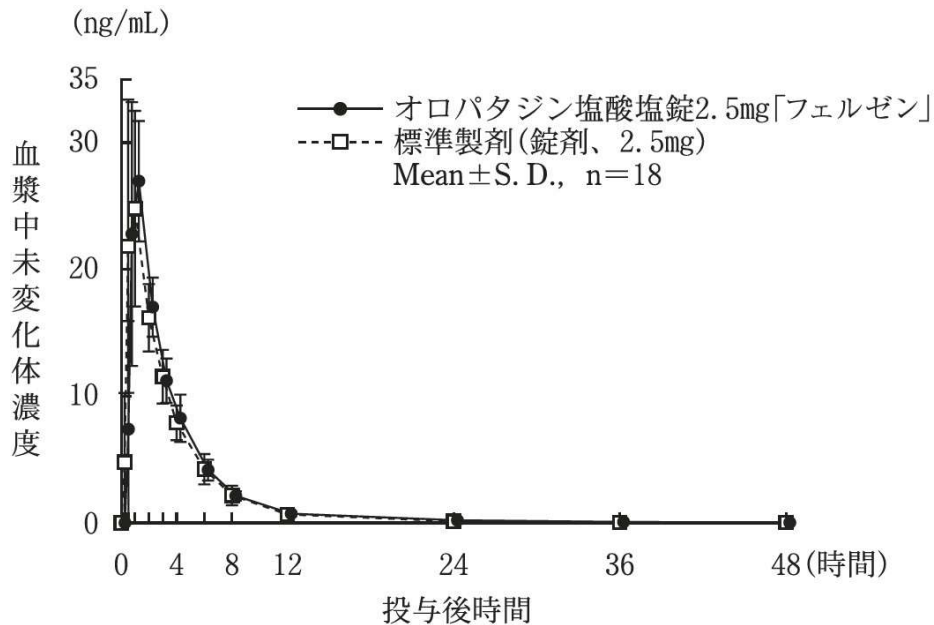
試験結果および考察

1. オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「フェルゼン」

試験製剤および標準製剤の薬物血中濃度－時間曲線下面積（ AUC_{0-48} ）は、各々 $95.12 \pm 12.35 \text{ng} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ 、 $89.93 \pm 11.24 \text{ng} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ 、最高血中濃度（ C_{max} ）は、各々 $30.07 \pm 6.09 \text{ng}/\text{mL}$ 、 $28.19 \pm 6.22 \text{ng}/\text{mL}$ 、最高血中濃度到達時間（ T_{max} ）は、各々 $0.8 \pm 0.3 \text{hr}$ 、 $0.9 \pm 0.5 \text{hr}$ 、血中濃度半減期（ $T_{1/2}$ ）は、各々 $8.95 \pm 7.11 \text{hr}$ 、 $5.77 \pm 5.54 \text{hr}$ 、また、消失速度定数（ kel ）は、各々 $0.1107 \pm 0.0538 \text{hr}^{-1}$ 、 $0.2189 \pm 0.1414 \text{hr}^{-1}$ であった。

AUC_{0-48} における対数変換値の平均値の差の 90%信頼区間は $\log(1.0175) \sim \log(1.0988)$ 、また、 C_{max} における対数変換値の平均値の差の 90%信頼区間は、 $\log(0.9593) \sim \log(1.1956)$ であり ともに $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲にあったことから、両製剤は生物学的に同等であると判定された。

血漿中薬物濃度の推移



薬物動態パラメータ

(Mean±SD, n=18)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「フェルゼン」	95.12±12.35	30.07±6.09	0.8±0.3	9.0±7.1
標準製剤 (錠剤, 2.5mg)	89.93±11.24	28.19±6.22	0.9±0.5	5.8±5.5

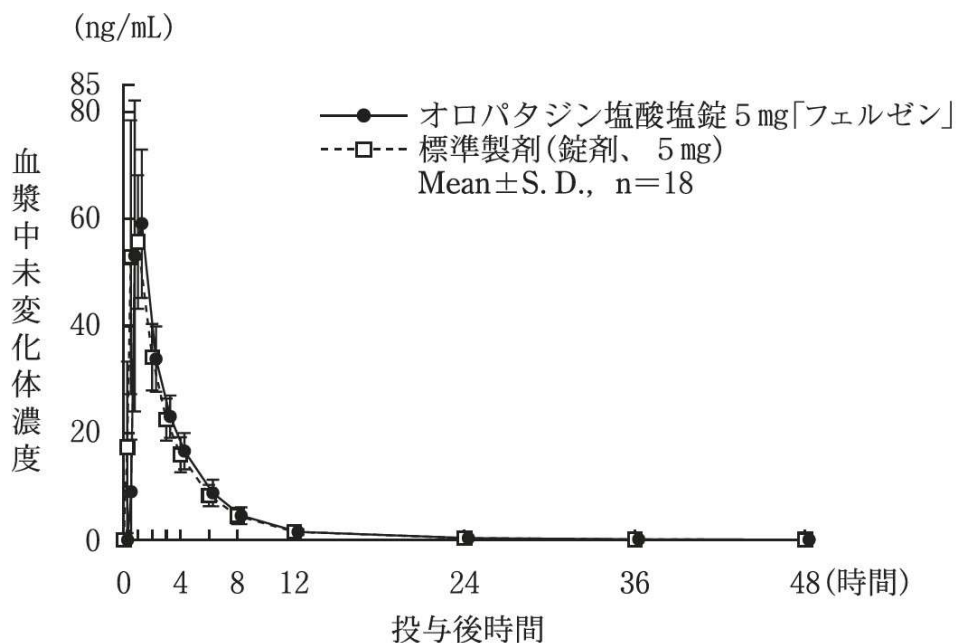
パラメータ	AUC ₀₋₄₈	C _{max}	判定基準
90%信頼区間 (log)	1.0175~1.0988	0.9593~1.1956	0.80~1.25

2. オロパタジン塩酸塩錠 5mg「フェルゼン」

試験製剤及び標準製剤の薬物血中濃度-時間曲線下面積 (AUC₀₋₄₈) は、各々 197.35±33.79ng·hr/mL、194.36±26.38ng·hr/mL、最高血中濃度 (C_{max}) は、各々 68.46±22.55ng/mL、65.85±18.04ng/mL、最高血中濃度到達時間 (T_{max}) は、各々 0.8±0.3hr、0.8±0.4hr、血中濃度半減期 (T_{1/2}) は、各々 8.38±6.08hr、8.81±9.28hr、消失速度定数 (kel) は、各々 0.1147±0.0511hr⁻¹、0.1269±0.0723hr⁻¹であった。

AUC₀₋₄₈における対数変換値の平均値の差の90%信頼区間は $\log(0.9449) \sim \log(1.0802)$ 、また、C_{max}における対数変換値の平均値の差の90%信頼区間は $\log(0.9001) \sim \log(1.1626)$ であり、ともに $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲にあったことから、両製剤は生物学的に同等であると判断された。

血漿中薬物濃度の推移



薬物動態パラメータ (Mean±SD, n=18)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「フェルゼン」	197.35±33.79	68.46±22.55	0.8±0.3	8.4±6.1
標準製剤 (錠剤, 5mg)	194.36±26.38	65.85±18.04	0.8±0.4	8.8±9.3

パラメータ	AUC ₀₋₄₈	C _{max}	判定基準
90%信頼区間 (log)	0.9449~1.0802	0.9001~1.1626	0.80~1.25