

テモカプリル塩酸塩錠 1mg、2mg、4mg 「フェルゼン」

生物学的同等性試験に関する資料

販 売 元：株式会社フェルゼンファーマ

製造販売元：ダイト株式会社

テモカプリル塩酸塩錠 1mg、2mg「フェルゼン」

生物学的同等性試験に関する資料

(1) テモカプリル塩酸塩錠 1mg「フェルゼン」

テモカプリル塩酸塩錠 1mg「フェルゼン」は、「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成12年2月14日医薬審第64号、平成18年11月24日付 薬食審査発第1124004号 別紙2)」に基づき、テモカプリル塩酸塩錠 2mg「フェルゼン」を標準剤としたとき、溶出挙動が同等と判定され、生物学的に同等とみなされた。

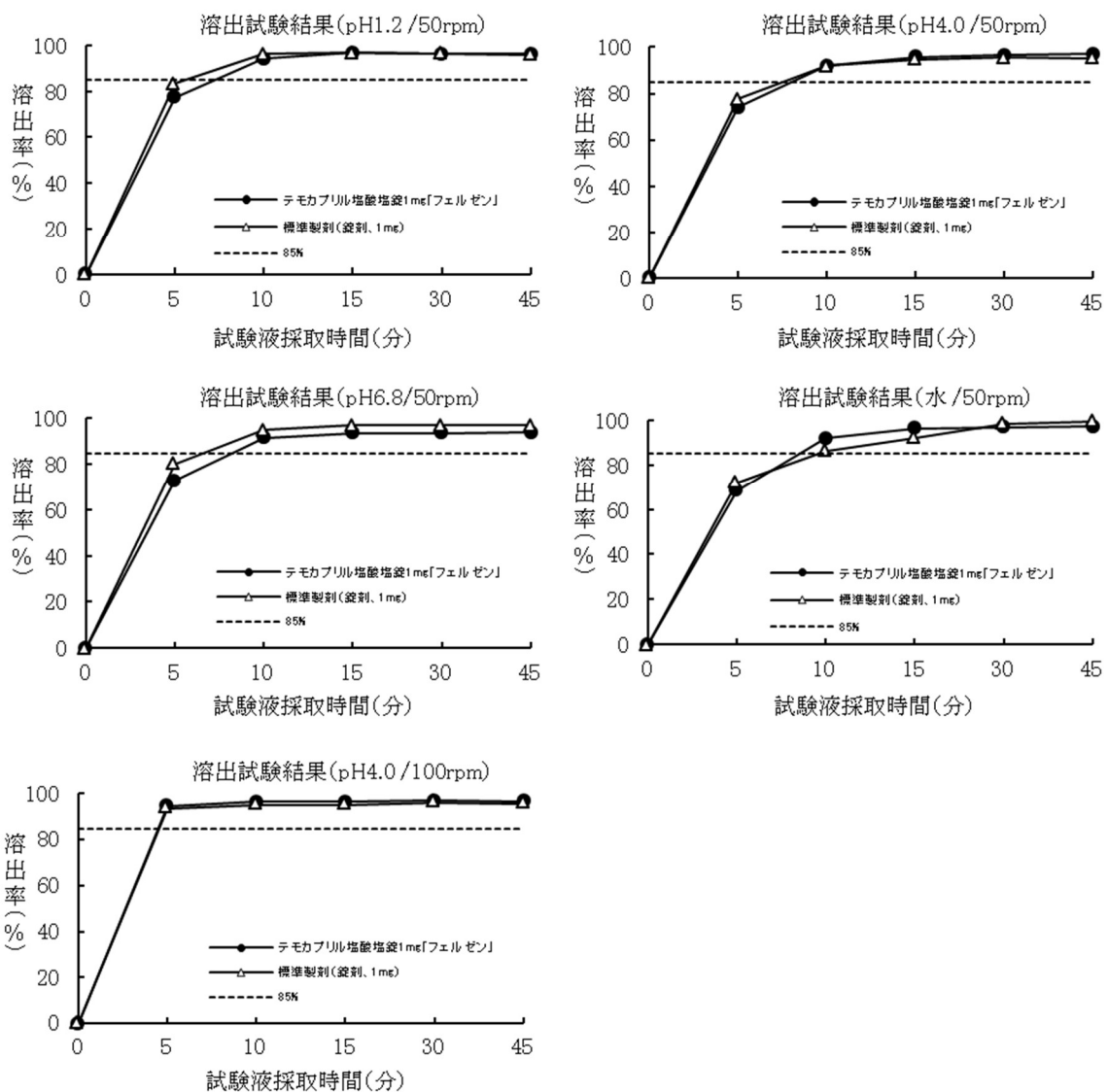
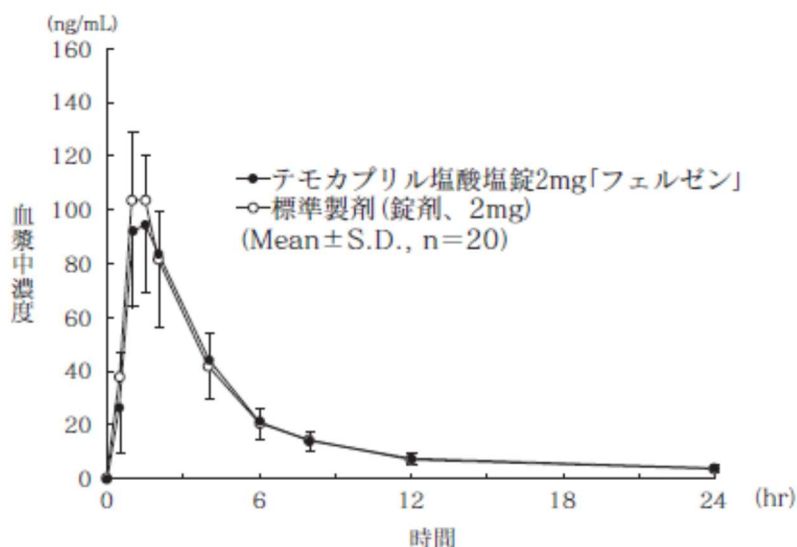


表 溶出挙動の同等性の判定結果

試験条件		判定基準		平均溶出率 (%)		判定	個々の溶出率		
回転数	試験液	溶出率	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤		判定基準		判定
							±15% 1個以下	±25% なし	
50rpm	pH1.2	85%以上	15	96.6	96.8	適	0	0	適
	pH4.0			94.6	95.7	適	0	0	適
	pH6.8			96.9	93.7	適	0	0	適
	水			92.3	96.4	適	0	0	適
100rpm	pH4.0			95.2	96.6	適	0	0	適

(2) テモカプリル塩酸塩錠 2mg 「フェルゼン」

本剤と標準製剤（錠剤、2mg）をクロスオーバー法により、健康成人男子 20 名にそれぞれ 1 錠（テモカプリル塩酸塩として 2mg）を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.5、1、1.5、2、4、6、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MS により測定したテモカプリラート（テモカプリルの活性代謝物）の血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は $\log 0.8 \sim \log 1.25$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



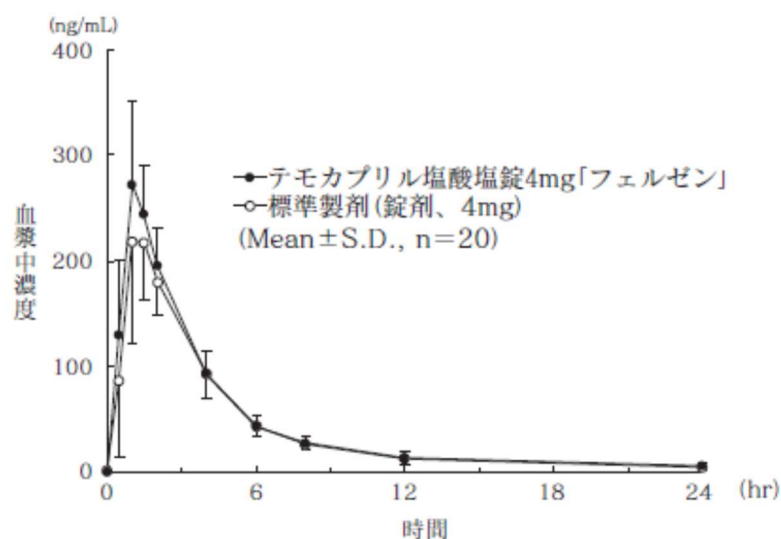
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng · hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
テモカプリル塩酸塩錠 2mg 「フェルゼン」	461.92±88.60	106.71±22.91	1.4±0.4	8.6±1.4
標準製剤 (錠剤、2mg)	478.10±116.72	114.71±35.03	1.4±0.7	8.3±1.1

(Mean ± S.D., n=20)

血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) テモカプリル塩酸塩錠 4mg 「フェルゼン」

本剤と標準製剤（錠剤、4mg）をクロスオーバー法により、健康成人男子 20 名にそれぞれ 1 錠（テモカプリル塩酸塩として 4mg）を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.5、1、1.5、2、4、6、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MS により測定したテモカプリラート（テモカプリルの活性代謝物）の血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は $\log 0.8 \sim \log 1.25$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
テモカプリル塩酸塩錠 4mg 「フェルゼン」	1044.18±184.60	291.03±56.61	1.1±0.2	6.9±0.6
標準製剤 (錠剤、4mg)	960.64±144.64	253.67±60.93	1.3±0.4	6.7±0.7

(Mean ± S.D., n=20)

血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。