

アズレン顆粒 1%「ツルハラ」
生物学的同等性に関する資料

鶴原製薬株式会社

2013年8月作成

アズレン顆粒 1%「ツルハラ」と標準製剤との血中濃度比較による検討

1. 緒言

アズレン顆粒 1%「ツルハラ」と標準製剤との生物学的同等性を検討するため、両製剤投与後の血清中アズレンスルホン酸ナトリウム水和物濃度推移を比較した。

2. 実験方法

(1) 使用薬剤

被験薬 アズレン顆粒 1%「ツルハラ」

対照薬 標準製剤

(2) 対象

あらかじめ健康診断を実施し、異常の認められなかった健康成人男子12名

(3) 投与量

製剤試験により同等と認められた両製剤 0.5g(アズレンスルホン酸ナトリウム水和物として5mg)ずつを空腹時経口投与した。

(4) 投与方法

ボランティア 12 名を 6 名ずつ 2 群に分け、医師の間診ののち、1 群にアズレン顆粒 1%「ツルハラ」、他群には標準製剤を同時に水 150mL とともに経口投与した。経時的に採血し血清中アズレンスルホン酸ナトリウム水和物濃度を測定した。その後 1 週間の休薬期間をおいた後、薬剤を替えて投与するクロスオーバー法により試験し血清中アズレンスルホン酸ナトリウム水和物濃度を測定した。なお前夜午後 8 時以降より約 12 時間絶食状態で投与した。

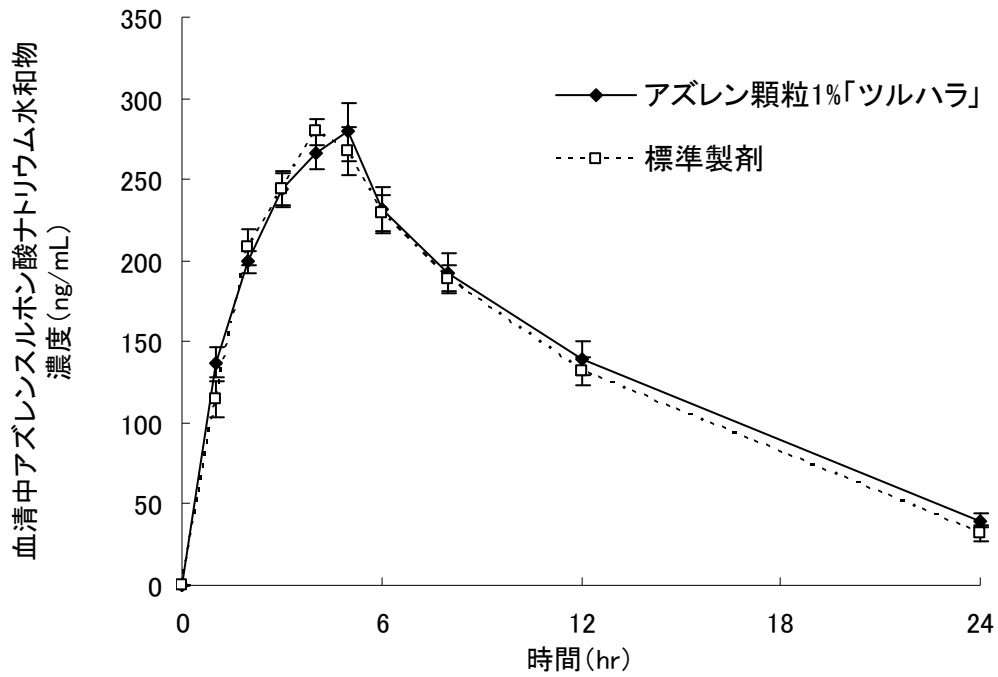
(5) 採血時間

投与前、1 時間、2 時間、3 時間、4 時間、5 時間、6 時間、8 時間、12 時間、24 時間目

3. 結果

血清中アズレンスルホン酸ナトリウム水和物濃度は、投与後 3～5 時間で 210～409ng/mL の最高血清中濃度に達した後、徐々に減少した。

アズレン顆粒 1%「ツルハラ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 0.5g(アズレンスルホン酸ナトリウム水和物 5mg)を健康成人男子に絶食時単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



平均値±S.E.、n=12

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
アズレン顆粒1%「ツルハラ」	3406.3±175.2	294.0±16.1	4.3±0.2	8.7±0.8
標準製剤 (細粒、1%)	3266.7±104.7	292.3±11.6	4.2±0.2	9.1±1.4

(Mean±S.E.、n=12)

血清中濃度並びに 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。