

シロスタゾールOD錠 100mg 「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

2014年10月作成

シロスタゾールOD錠 100mg「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

シロスタゾールOD錠 100mg「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、両製剤投与後の血漿中シロスタゾール濃度推移を比較した。

2. 実験方法

(1) 使用薬剤

シロスタゾールOD錠 100mg「ツルハラ」

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 20 名

(3) 投与量

製剤試験により同等と認められた両製剤 1 錠（シロスタゾールとして 100mg）を健康成人男子に絶食時単回経口投与（水で服用及び水無しで服用）

(4) 投与方法

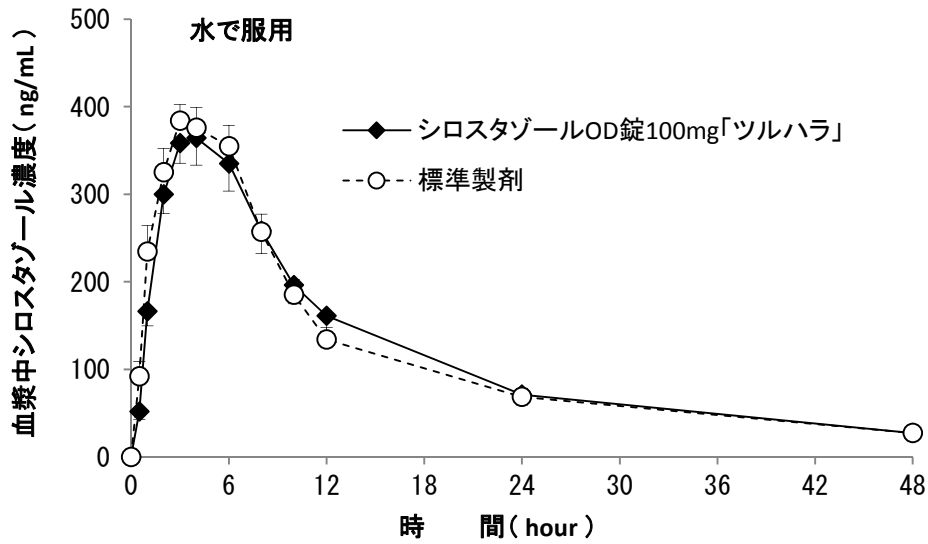
【水あり投与の場合】は、絶食時に 1 錠を水 150mL とともに単回経口投与し、【水なし投与の場合】は、絶食時に 1 錠を舌の上で溶かし、唾液とともに単回経口投与し、血漿中のシロスタゾール濃度を経時的に測定した。

(5) 採血時間

投与前、0.5 時間、1 時間、2 時間、3 時間、4 時間、6 時間、8 時間、10 時間、12 時間、24 時間、48 時間目

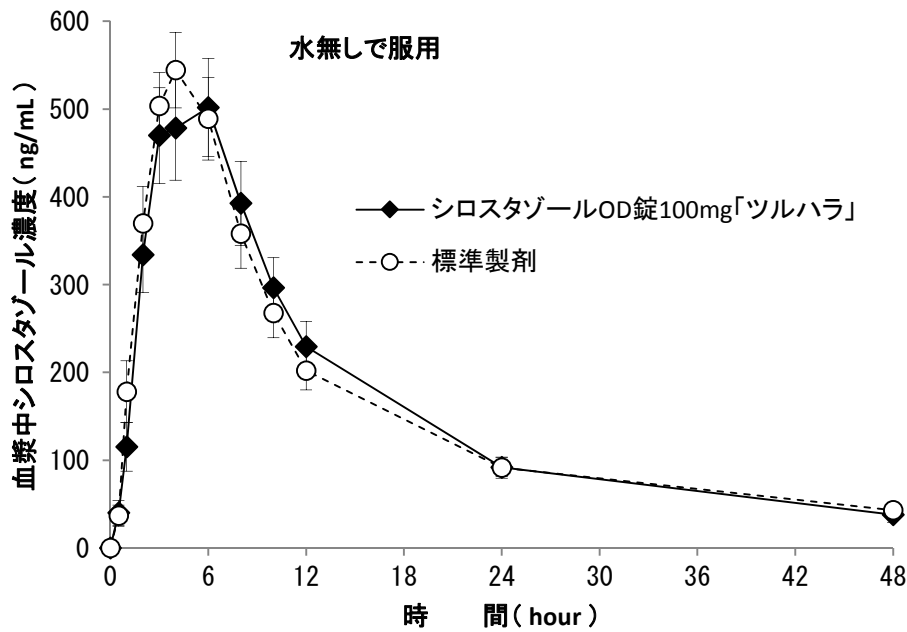
3. 結果

【水あり投与の場合】は投与後 1.0～8.0 時間目に最高血中濃度に達し、【水なし投与の場合】は投与後 1.0～10.0 時間目に最高血中濃度に達し、徐々に減少した。この結果につき統計解析を行い、両製剤の Bioavailability の差の推定信頼区間を求めると、【水あり投与の場合】は AUC₀₄₈（対数変換）では $\log(0.8883) \sim \log(1.0850)$ 、C_{max}（対数変換）では $\log(0.8155) \sim \log(1.0292)$ 、【水なし投与の場合】は AUC₀₄₈（対数変換）では $\log(0.9224) \sim \log(1.0924)$ 、C_{max}（対数変換）では $\log(0.8397) \sim \log(1.1149)$ が得られ、同等の判定基準である「対数の平均値の差の信頼区間が $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ 以内である」の範囲の内であったため両製剤は生物学的に同等であると判断された



	AUC ₀₋₄₈ (ng · hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
シロスタゾール OD 錠 100mg 「ツルハラ」	5671±535	397.9±29.7	3.7±0.4	28.7±14.5
標準製剤 (OD 錠、100mg)	5592±357	422.7±21.2	3.6±0.3	21.9± 6.8

mean±S.E. (n=20)



	AUC ₀₋₄₈ (ng · hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
シロスタゾール OD 錠 100mg 「ツルハラ」	7710±662	592.5±51.8	4.3±0.5	14.7±1.8
標準製剤 (OD 錠、100mg)	7650±602	598.0±43.6	3.9±0.4	24.7±7.8

mean±S.E. (n=20)

血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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。