

レスポリックス配合顆粒
生物学的同等性に関する資料

鶴原製薬株式会社

レスポリックス配合顆粒と標準製剤との血中濃度比較による検討

1. 緒言

レスポリックス配合顆粒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ジサイクロミン塩酸塩濃度推移を比較した。

なお、乾燥水酸化アルミニウムゲルおよび酸化マグネシウムは吸収されて効果を発揮するものでなく、胃内で制酸作用を示し総合的に潰瘍、胃炎等を軽減せしめるものである。よって文献等を参考にラットによる実験潰瘍モデル(ストレス潰瘍モデル、レセルピン潰瘍モデル)に対する抗潰瘍効果を比較検討した。その結果両製剤の潰瘍抑制効果は確認され、両製剤間に有意差は認められなかった。

2. 実験方法

(1) 使用薬剤

レスポリックス配合顆粒

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各 2g (ジサイクロミン塩酸塩として 10mg) ずつを空腹時経口投与した。

(4) 投与方法

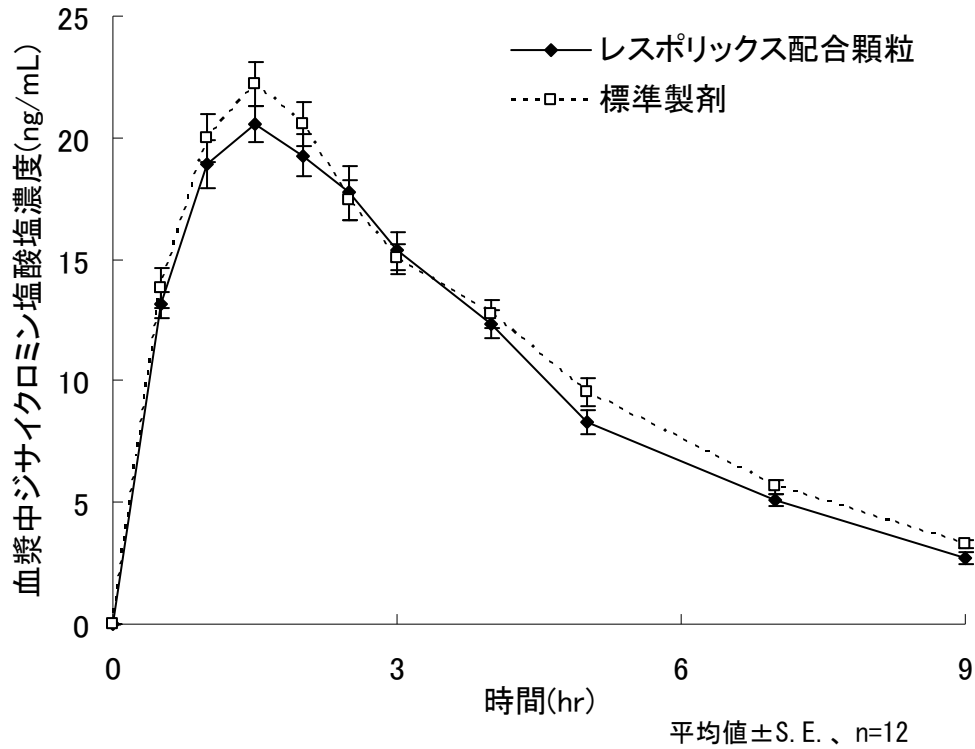
ボランティア 12 名を 6 名ずつ 2 群に分け、医師の問診ののち、1 群にレスポリックス配合顆粒、他群には標準製剤を同時に水 150mL とともに経口投与した。経時的に採血し血漿中ジサイクロミン塩酸塩濃度を測定した。その後 1 週間の休薬期間をおいた後、薬剤を替えて投与するクロスオーバー法により試験し血漿中ジサイクロミン塩酸塩濃度を測定した。

(5) 採血時間

投与前、0.5 時間、1 時間、1.5 時間、2 時間、2.5 時間、3 時間、4 時間、5 時間、7 時間、9 時間目

3. 結果

血漿中ジサイクロミン塩酸塩濃度は、投与後すみやかに上昇し約 1.0～2.5 時間で 16.2～27.5ng/mL の最高血漿中濃度に達した後、比較的すみやかに減少した。得られた薬物動態パラメータ (AUC、C_{max}) 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。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₉ (ng · hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レスポリックス 配合顆粒	94.0 ± 3.6	21.6 ± 1.0	1.5 ± 0.1	2.5 ± 0.1
標準製剤 (顆粒、1%)	100.0 ± 4.2	22.5 ± 0.9	1.5 ± 0.1	2.7 ± 0.2

(Mean ± S.E., n=12)

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。