

ポナペルト細粒

(ロキソプロフェンナトリウム製剤)

生物学的同等性に関する資料

・ 富士カプセル株式会社
安全管理室

◎目的

当社製剤ポナペルト細粒と先発製剤ロキソニン細粒(三共株式会社)との2製剤間の生物学的同等性を血漿中ロキソプロフェン濃度を測定することにより検討した。

◎使用薬剤

試験製剤：ポナペルト細粒(富士カプセル株式会社)

1包(1mg)中ロキソプロフェンナトリウム 113.4mg 含有：Lot.No FK-102
(無水物として100mg含有)

標準製剤：ロキソニン細粒(三共株式会社)

1包(1mg)中ロキソプロフェンナトリウム 113.4mg：Lot.No P023L
(無水物として100mg含有)

◎実施時期

平成7年6月19日～平成7年8月5日

◎被験者

健康な成人男子14名/年齢：21～40歳(平均26歳)/身長：164.6～179.0cm(平均172.1cm)
/体重：53～86.0kg(平均66.1kg)

◎投与条件及び投与量

被験者は投与前10時間以上絶食後、空腹時、試験製剤または標準製剤のいずれか1包を水150mLと共に単回経口投与した。投与後4時間以上は絶食させた。

◎実施方法及び休薬期間

表1に従って非盲検で実施。健康成人男子14名を無作為に各7名の2群(A・B群)に分け、休薬期間を7日間とするクロスオーバー法により実施した。

表1 被験者の割り付け

群	被験者数	第一期(単回経口投与)	休薬期間	第二期(単回経口投与)
A	7	標準製剤：ロキソニン細粒 1包	7日間	試験製剤：ポナペルト細粒 1包
B	7	試験製剤：ポナペルト細粒 1包		標準製剤：ロキソニン細粒 1包

◎薬物濃度の測定

- 1)採血時点：投与前、投与後0.25、0.5、0.75、1、1.5、2、3、4、及び6時間目
- 2)採血量：各時点10mL
- 3)測定：高速液体クロマトグラフ法により血漿中ロキソプロフェン濃度を測定

◎評価項目

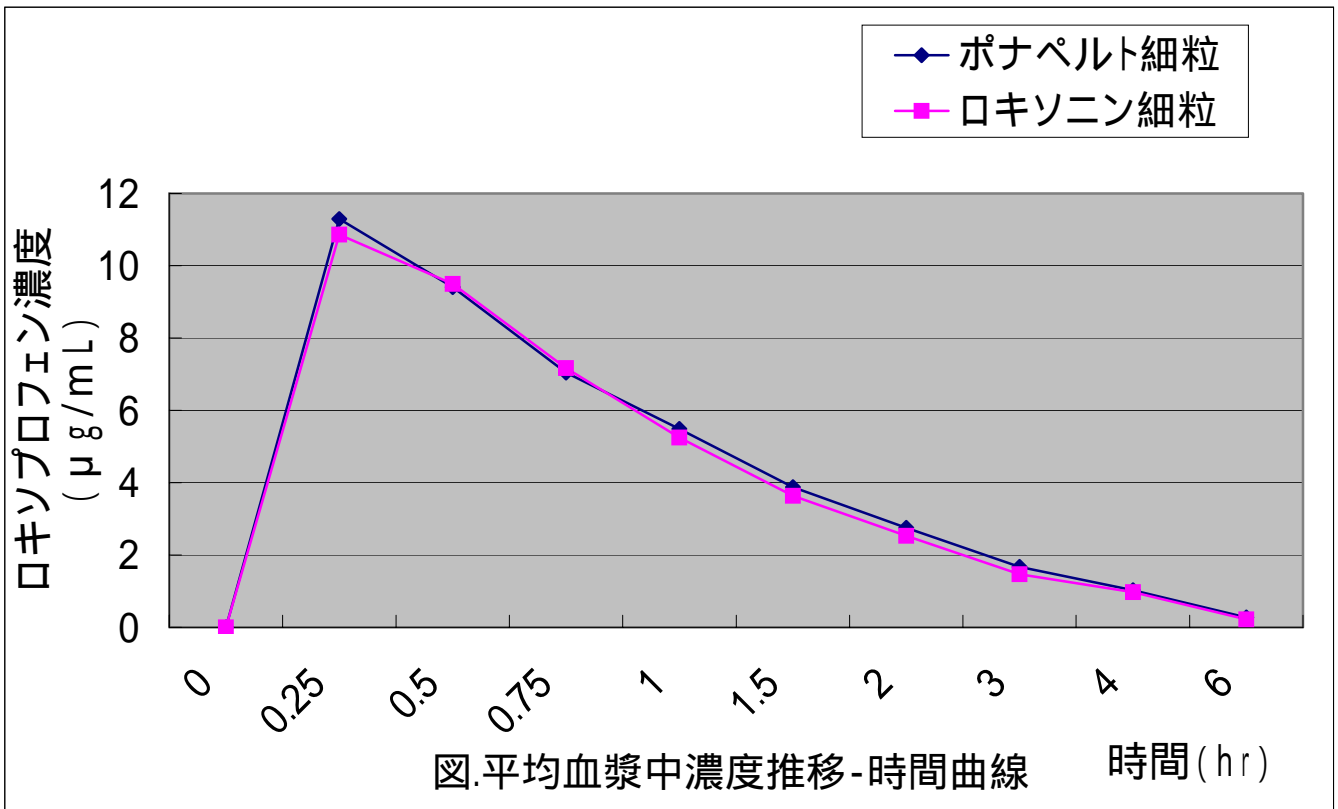
血漿中ロキソプロフェン濃度をもとにAUC、Cmaxなどの薬物動態パラメーターを算出し、2製剤間の生物学的同等性を検証した。

◎結果

健康な成人男子 14 人に試験薬：ポナペルト細粒 1 包と、標準製剤：ロキソニン細粒 1 包を投与した結果、血漿中薬物濃度は図. のように推移し、AUC、Cmax、Tmax、 $T_{1/2}$ は表 2 に示すとおりであった。

表 2 平均薬物動態パラメータ

	AUC ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
ロキソニン細粒	15.71 \pm 1.22	12.51 \pm 0.75	0.34 \pm 0.04	0.92 \pm 0.04
ポナペルト細粒	16.49 \pm 1.17	12.36 \pm 0.60	0.35 \pm 0.04	0.98 \pm 0.07



◎結論

試験製剤：ポナペルト細粒(富士カプセル株式会社)と、標準製剤：ロキソニン細粒(三共株式会社)の生物学的同等性を評価するにあたり、14名の健康な成人男子志願者を対象にクロスオーバー法による生物学的同等性を行い、以下の結果が得られた。

- 1) 試験製剤及び標準製剤の経口投与後の血漿中ロキソプロフェン濃度は、近似した推移を示した。
- 2) 分散分析において Cmax 並びに AUC とともに薬剤に有意差は認められず、生物学的同等性の判定項目である両パラメータ対数変換値における平均値の差の 95%信頼区間は、いずれも 20%以内の範囲内であった。

以上より、両製剤は生物学的に同等な製剤であると判定された。