

アリピプラゾール散 1%「オーハラ」の 生物学的同等性試験について

体内薬物動態に関する資料

大原薬品工業株式会社

アリピプラゾール散 1%「オーハラ」の生物学的同等性に関する資料

【要約】

日本人健康成人男子を対象として、アリピプラゾール散 1%「オーハラ」（大原薬品工業株式会社）と標準製剤（散剤、1%）との体内薬物動態による生物学的同等性を 2 剤 2 期のクロスオーバー法により試験した。その結果、指標としたアリピプラゾール散 1%「オーハラ」と標準製剤との血漿中未変化体濃度の AUC_{0-168} 及び C_{max} はガイドライン*の判定基準に適合し、両製剤は生物学的に同等であると判定された。

*：後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）

【試験材料及び試験方法】

1. 投与量

アリピプラゾール散 1%「オーハラ」及び標準製剤のそれぞれ 0.3g（アリピプラゾールとして 3mg）を絶食下、経口単回投与した。

2. 採血ポイント

治験薬投与前、投与後 0.5、0.75、1、1.5、2、2.5、3、4、5、6、8、12、24、48、72 及び 168 時間

3. 治験薬

	被験薬	対照薬
名称	アリピプラゾール散 1%「オーハラ」	標準製剤（散剤、1%）
Lot No.	APZ903	—
剤形	白色・散剤	白色・散剤
成分・含有量	1g 中アリピプラゾール 10mg を含有	
製造会社	大原薬品工業株式会社	—

4. 被験者

日本人健康成人男子 18 例

5. 試験方法

絶食下、被験者 18 例を無作為に 1 群 9 例の 2 群に割り付けた。被験者にアリピプラゾール散 1%「オーハラ」又は標準製剤のそれぞれ 1 錠（いずれもアリピプラゾールとして 6mg）を単回経口投与する 2 剤 2 期のクロスオーバー法により試験した。

6. 評価項目及び定量法

生物学的同等性は血漿中アリピプラゾール濃度の AUC 及び C_{max} で評価し、定量は LC/MS/MS 法により行った。

【試験結果及び考察】

1. 血漿中アリピプラゾール濃度の推移

アリピプラゾール散 1%「オーハラ」及び標準製剤投与後の血漿中アリピプラゾール濃度は、ほぼ同様の推移を示した（図 1）。

アリピプラゾール散 1%「オーハラ」及び標準製剤の平均の AUC_{0-168} 、 C_{max} 、 t_{max} 及び $t_{1/2}$ は、表 1 に示すようにほぼ一致した。

アリピプラゾール散 1%「オーハラ」及び標準製剤の AUC_{0-168} 、 C_{max} に対する対数値の平均値の差の 90%信頼区間はそれぞれ、 AUC_{0-168} : $\log(0.9843) \sim \log(1.0633)$ 、 C_{max} : $\log(0.9408) \sim \log(1.1525)$ であり、生物学的同等性の判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ を満たしていた。

以上の結果から、アリピプラゾール散 1%「オーハラ」及び標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

表 1 アリピプラゾール散 1%「オーハラ」及び標準製剤投与後の薬物動態パラメータ

治験薬	AUC_{0-168} (ng·hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	t_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
アリピプラゾール散 1%「オーハラ」	715.4±200.1	17.51±3.69	2.08±1.39	59.71±14.04
標準製剤 (散剤、1%)	697.9±191.0	17.12±5.12	1.81±1.07	60.55±13.34

各値は Mean±S. D.

(n = 18)

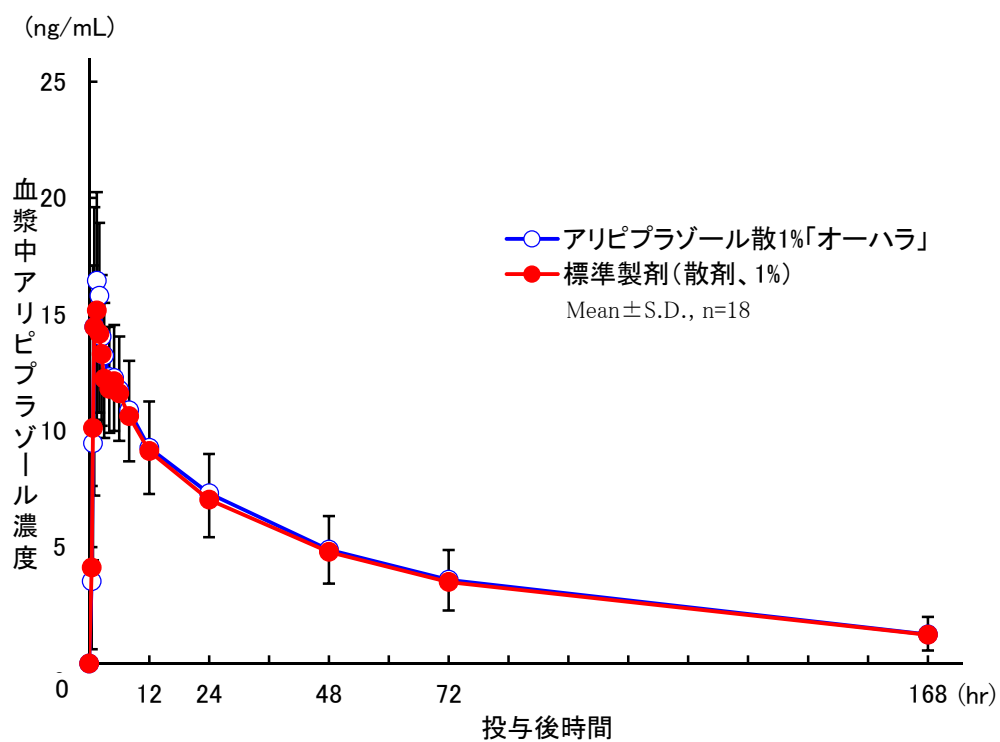


図1 アリピプラゾール散1%「オーハラ」及び標準製剤投与後の血漿中アリピプラゾール濃度推移