エペリゾン塩酸塩錠 50mg「日新」の生物学的同等性に関する資料

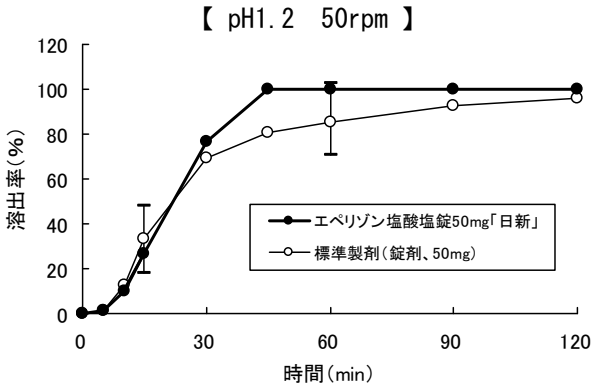
日新製薬株式会社

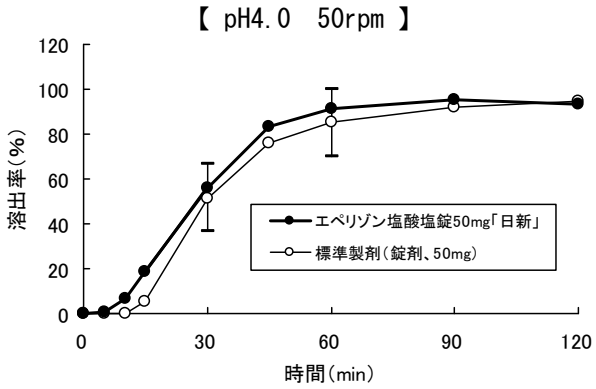
１．溶出試験

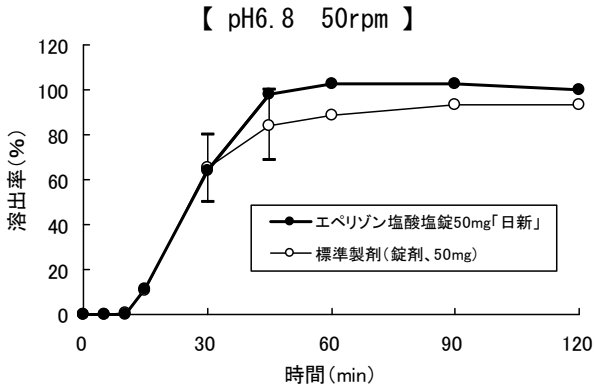
エペリゾン塩酸塩錠 50mg「日新」（日新製薬）及び標準製剤（錠剤、エペリゾン塩酸塩として 50mg）について、日本薬局方溶出試験第２法により、４種試験液（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）、50rpm における溶出試験を実施した。

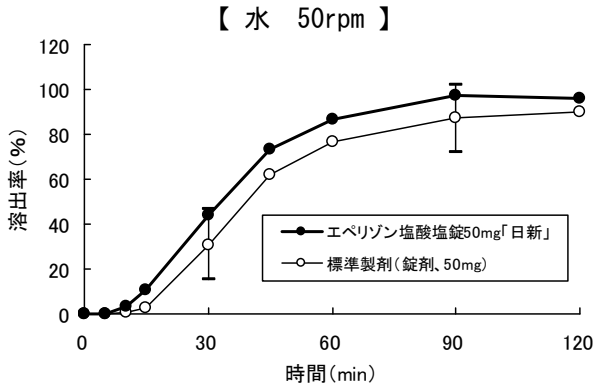
その結果、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン　４．溶出挙動の同等性の判定」に従い判定するとき、エペリゾン塩酸塩錠 50mg「日新」と標準製剤の溶出挙動は同等であると判定された。

また、エペリゾン塩酸塩錠 50mg「日新」は、日本薬局方外医薬品規格第３部に定められた塩酸エペリゾン 50mg 錠の溶出規格（水、50rpm：90 分、70%以上）に適合していることが確認されている。









試験液	判定
pH1.2	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
pH4.0	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
pH6.8	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。
水	判定ポイントにおいて、試験製剤は標準製剤の±15%の範囲にあった。

※判定ポイントにおける標準製剤の平均溶出率の±15%の範囲を ⊖ で示す。

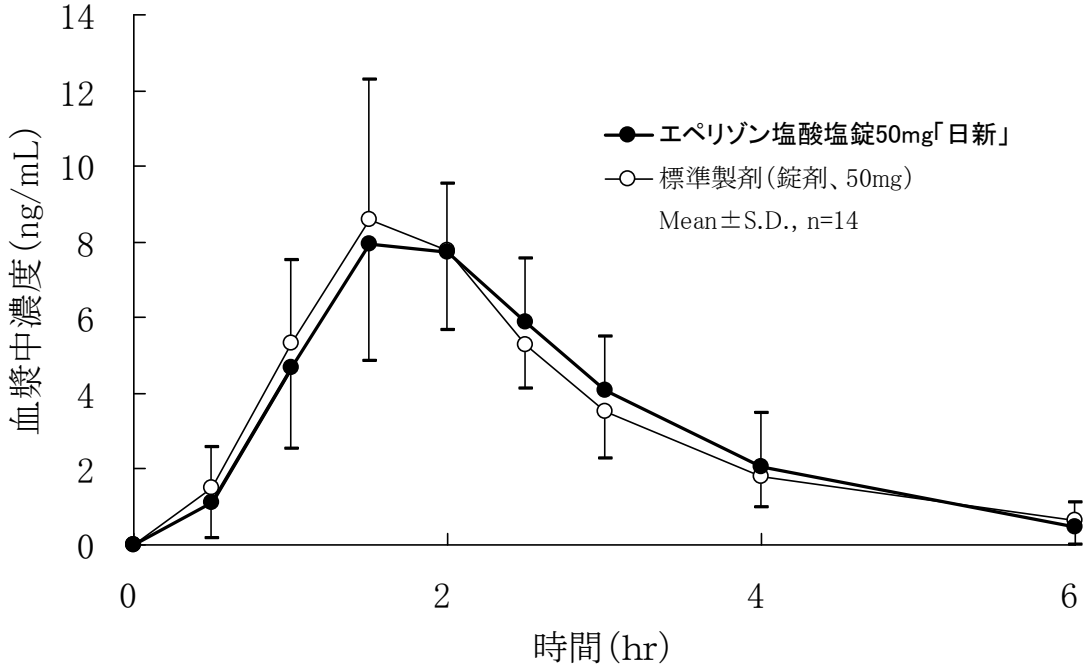
（裏面へ続く）

2．血漿中濃度比較試験

健康成人男子 14 名に、エペリゾン塩酸塩錠 50mg「日新」及び標準製剤（錠剤、50mg）を、それぞれ 3 錠（エペリゾン塩酸塩として 150mg）絶食時単回経口投与し、1 週間の休薬期間をおいた 2 剤 2 期クロスオーバー法で両製剤の血漿中濃度を比較検討した。

その結果、エペリゾン塩酸塩の血漿中未変化体濃度推移は以下に示したとおりで、最高血漿中濃度到達時間Ｔmax はエペリゾン塩酸塩錠 50mg「日新」が 1.71 時間、標準製剤が 1.64 時間で、最高血漿中濃度 Cmax はそれぞれ 8.96ng/mL、9.39ng/mL、消失半減期 $T_{1/2}$ はそれぞれ 1.06 時間、1.21 時間と算出された。

得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。



薬剤名	血漿中濃度（ng / mL）									AUC_{0-6}	Cmax	Tmax	$T_{1/2}$
	0 hr	0.5 hr	1 hr	1.5 hr	2 hr	2.5 hr	3 hr	4 hr	6 hr	(ng･hr/mL)	(ng/mL)	(hr)	(hr)
エペリゾン塩酸塩錠50mg「日新」	0.00	1.10	4.67	7.94	7.73	5.87	4.06	2.07	0.48	20.29	8.96	1.71	1.06
±S.D.	−	0.93	2.13	3.07	2.06	1.70	1.44	1.39	0.51	6.18	2.56	0.32	0.41
標準製剤（錠剤、50mg）	0.00	1.50	5.32	8.60	7.79	5.27	3.54	1.80	0.64	20.23	9.39	1.64	1.21
±S.D.	−	1.08	2.18	3.68	1.74	1.15	1.25	0.83	0.49	4.46	3.38	0.31	0.44

（n=14）

3．まとめ

エペリゾン塩酸塩錠 50mg「日新」と標準製剤（錠剤、50mg）は生物学的に同等であり、臨床の場においても同等の効果が期待できると判断した。

2014 年 9 月改訂