

# アスコルビン酸注 500mgPB「日新」の 生物学的同等性に関する資料

日新製薬株式会社

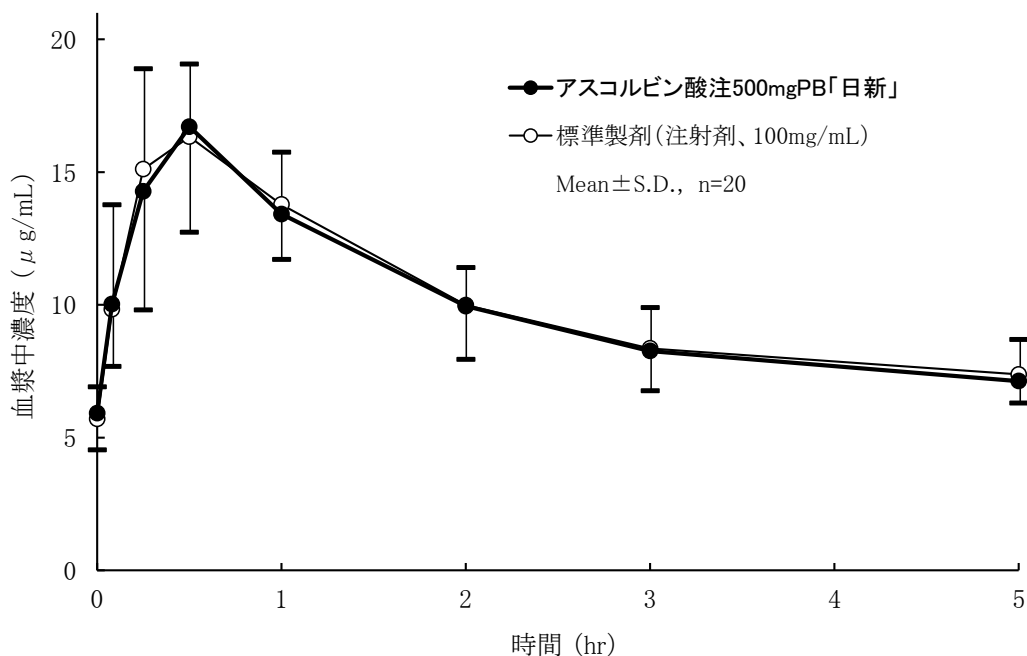
## 1. 血漿中濃度比較試験

### 1-1. 皮下投与における血漿中濃度比較試験

雄性ビーグル犬 20 頭に、アスコルビン酸注 500mgPB「日新」(日新製薬、アスコルビン酸として 100mg/mL 含有) 及び標準製剤(注射剤、アスコルビン酸として 100mg/mL) を、それぞれ 1 mL (アスコルビン酸として 100mg) 絶食時単回皮下投与し、10 日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。なお、各測定時間毎の血漿中濃度は Blank 値(0 時間での値) を差し引いた補正值で検定を行った。

その結果、アスコルビン酸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  $T_{max}$  はアスコルビン酸注 500mgPB「日新」が 0.46 時間、標準製剤が 0.50 時間で、最高血漿中濃度  $C_{max}$  はそれぞれ  $11.34 \mu\text{g/mL}$ 、 $11.49 \mu\text{g/mL}$ 、消失半減期  $T_{1/2}$  はそれぞれ 1.45 時間、1.56 時間と算出された。

得られた薬物動態パラメータ(AUC、 $C_{max}$ ) について統計解析を行った結果、両剤間に有意差は認められなかった。



薬剤名	血漿中濃度( $\mu\text{g/mL}$ )								AUC <sub>0-5</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$ )	$C_{max}$ ( $\mu\text{g/mL}$ )	$T_{max}$ (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
	0 hr	0.08 hr	0.25 hr	0.5 hr	1 hr	2 hr	3 hr	5 hr				
アスコルビン酸注500mgPB「日新」	5.92	10.03	14.28	16.71	13.42	9.95	8.26	7.13	20.70	11.34	0.46	1.45
± S.D.	0.98	3.73	4.48	2.35	1.72	2.01	1.50	0.84	3.68	2.25	0.17	0.42
標準製剤(注射剤、100mg/mL)	5.70	9.83	15.11	16.33	13.78	9.99	8.36	7.38	22.49	11.49	0.50	1.56
± S.D.	1.17	2.16	3.78	3.60	1.96	1.41	1.53	1.31	4.36	2.85	0.24	0.70

(n=20)

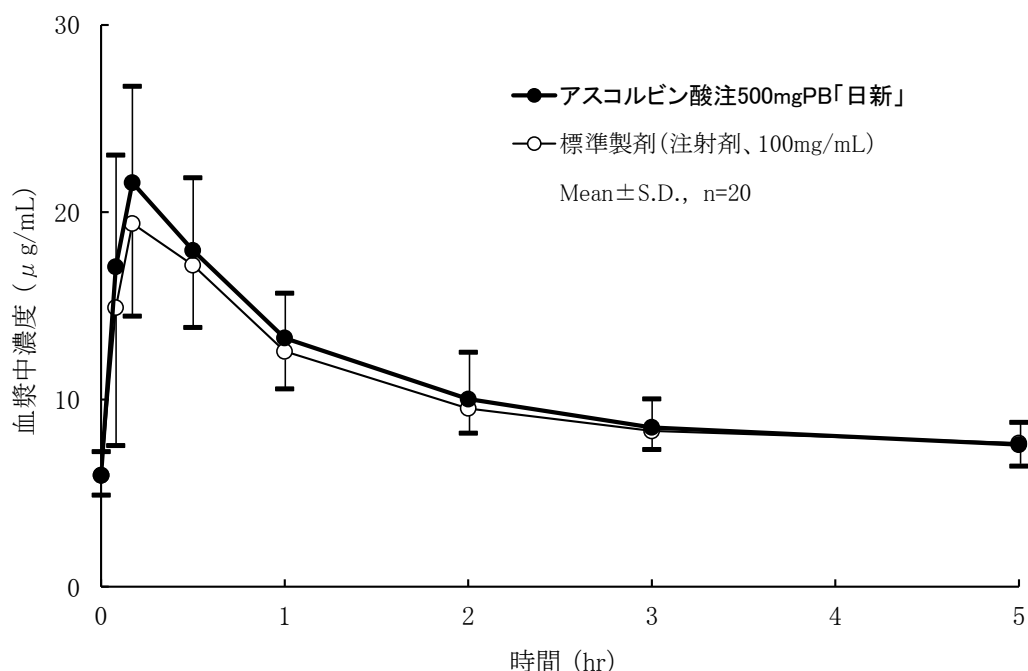
(裏面へ続く)

## 1-2. 筋肉内投与における血漿中濃度比較試験

雄性ビーグル犬 20 頭に、アスコルビン酸注 500mgPB「日新」(日新製薬、アスコルビン酸として 100mg/mL 含有) 及び標準製剤(注射剤、アスコルビン酸として 100mg/mL) を、それぞれ 1 mL (アスコルビン酸として 100mg) 絶食時単回筋肉内投与し、10 日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。なお、各測定時間毎の血漿中濃度は Blank 値 (0 時間での値) を差し引いた補正值で検定を行った。

その結果、アスコルビン酸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  $T_{max}$  はアスコルビン酸注 500mgPB「日新」が 0.20 時間、標準製剤が 0.26 時間で、最高血漿中濃度  $C_{max}$  はそれぞれ  $16.05 \mu\text{g/mL}$ 、 $15.70 \mu\text{g/mL}$ 、消失半減期  $T_{1/2}$  はそれぞれ 1.48 時間、1.55 時間と算出された。

得られた薬物動態パラメータ (AUC、 $C_{max}$ ) について統計解析を行った結果、両剤間に有意差は認められなかった。



薬剤名	血漿中濃度( $\mu\text{g/mL}$ )								AUC <sub>0-5</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$ )	$C_{max}$ ( $\mu\text{g/mL}$ )	$T_{max}$ (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
	0 hr	0.08 hr	0.17 hr	0.5 hr	1 hr	2 hr	3 hr	5 hr				
アスコルビン酸注500mgPB「日新」	5.95	17.08	21.58	17.96	13.28	10.02	8.51	7.59	24.24	16.05	0.20	1.48
±S.D.	1.25	5.96	5.13	3.87	2.38	2.49	1.51	1.16	4.76	3.79	0.10	0.47
標準製剤(注射剤、100mg/mL)	5.95	14.90	19.40	17.17	12.57	9.52	8.32	7.67	22.02	15.70	0.26	1.55
±S.D.	1.07	7.37	4.96	3.33	2.01	1.33	1.00	1.09	3.08	3.25	0.16	0.37

(n=20)

## 2. まとめ

アスコルビン酸注 500mgPB「日新」と標準製剤(注射剤、100mg/mL) 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。