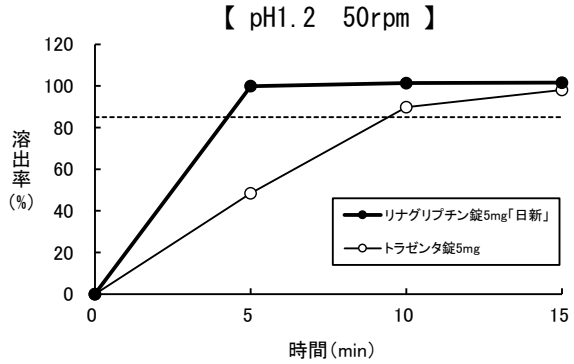
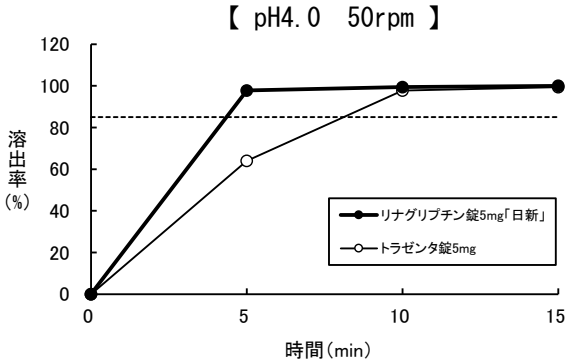
リナグリプチン錠5mg「日新」の生物学的同等性に関する資料

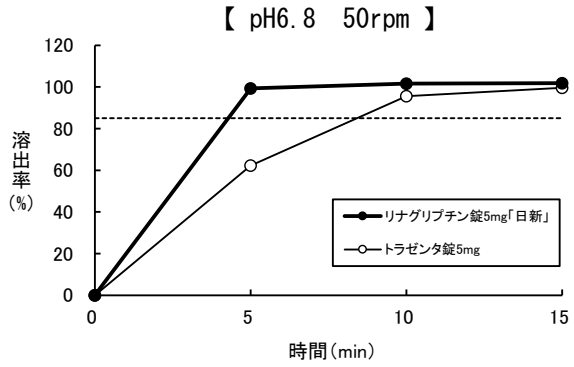
日新製薬株式会社

１．溶出挙動の類似性

リナグリプチン錠5mg「日新」（試験製剤）及びトラゼンタ錠5mg（標準製剤）のヒトでの生物学的同等性試験に先立ち、溶出挙動により両製剤の類似性を推察した。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．溶出挙動の類似性の判定」に従い判定するとき、いずれの場合においても溶出挙動が類似していると判定された。







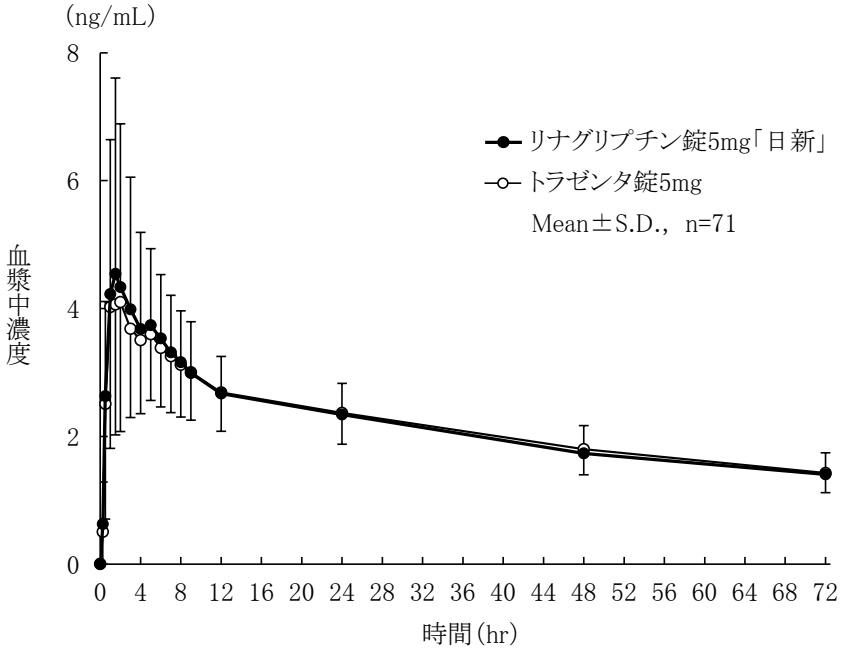
回転数	試験液	平均溶出率の判定
パドル法 50rpm	pH1.2、pH4.0、pH6.8	15分以内に平均85%以上溶出した。
パドル法 100rpm	全ての試験液において、パドル法、50rpmの溶出試験で、30分以内に標準製剤、試験製剤ともに平均85%以上溶出したため、試験を省略した。	

2．血漿中濃度比較試験

健康成人男性 71 名に、リナグリプチン錠 5mg「日新」及びトラゼンタ錠 5mg を、それぞれ 1 錠（リナグリプチンとして 5mg）絶食時単回経口投与し、56 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。

その結果、リナグリプチン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 はリナグリプチン錠 5mg「日新」が 3.0 時間、トラゼンタ錠 5mg が 3.1 時間で、最高血漿中濃度 C max はそれぞれ 5.37ng/mL、5.07ng/mL、消失半減期 $T_{1/2}$ はそれぞれ 68.31 時間、68.88 時間と算出された。

得られた薬物動態パラメータをもとに 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、0～72 時間までの血漿中濃度－時間曲線下面積 $AUC_{0\text{-}72}$ は log(0.9597)～log(1.0214)、Cmax は log(0.9249)～log(1.1446)であり、後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインが要求する log(0.80)～log(1.25)の範囲内であった。



薬剤名	血漿中濃度(ng/mL)																	$AUC_{0\text{-}72}$	Cmax	Tmax	$T_{1/2}$
	0 hr	0.25 hr	0.5 hr	1 hr	1.5 hr	2 hr	3 hr	4 hr	5 hr	6 hr	7 hr	8 hr	9 hr	12 hr	24 hr	48 hr	72 hr	(ng･hr/mL)	(ng/mL)	(hr)	(hr)
リナグリプチン錠5mg「日新」	0.01	0.63	2.63	4.23	4.54	4.34	3.99	3.68	3.74	3.53	3.31	3.16	2.99	2.67	2.34	1.73	1.41	156.85	5.37	3.0	68.31
±S.D.	0.03	0.65	1.48	2.41	3.07	2.55	2.07	1.51	1.20	1.00	0.89	0.80	0.74	0.59	0.46	0.34	0.29	33.06	3.02	2.2	18.29
トラゼンタ錠5mg	0.00	0.51	2.51	4.03	4.06	4.10	3.68	3.51	3.60	3.39	3.25	3.12	3.00	2.69	2.37	1.80	1.43	157.82	5.07	3.1	68.88
±S.D.	0.02	0.78	1.80	2.21	2.04	2.03	1.39	1.15	1.04	0.92	0.88	0.82	0.79	0.57	0.46	0.37	0.32	30.07	2.31	2.3	23.47

(n=71)

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。

3．まとめ

リナグリプチン錠 5mg「日新」とトラゼンタ錠 5mg 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。

2026 年 8 月作成