

ラベプラゾール Na 塩錠 10mg 「オーハラ」
の生物学的同等性に関する資料

第一三共エスファ株式会社

【要 約】

ラベプラゾール Na 塩錠 10mg「オーハラ」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ラベプラゾールナトリウムとして 10mg）、健康成人に絶食単回経口投与して血漿中ラベプラゾール濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）について統計解析した結果、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 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）

血漿中濃度比較試験

ラベプラゾール Na 塩錠 10mg「オーハラ」と標準製剤を 2 剤 2 期のクロスオーバー法に従い、健康成人男子 24 名に絶食単回経口投与し〔投与量：1 錠（ラベプラゾールナトリウムとして 10mg）、水 150mL〕、採取した血漿中ラベプラゾール濃度を LC/MS/MS 法で測定した。

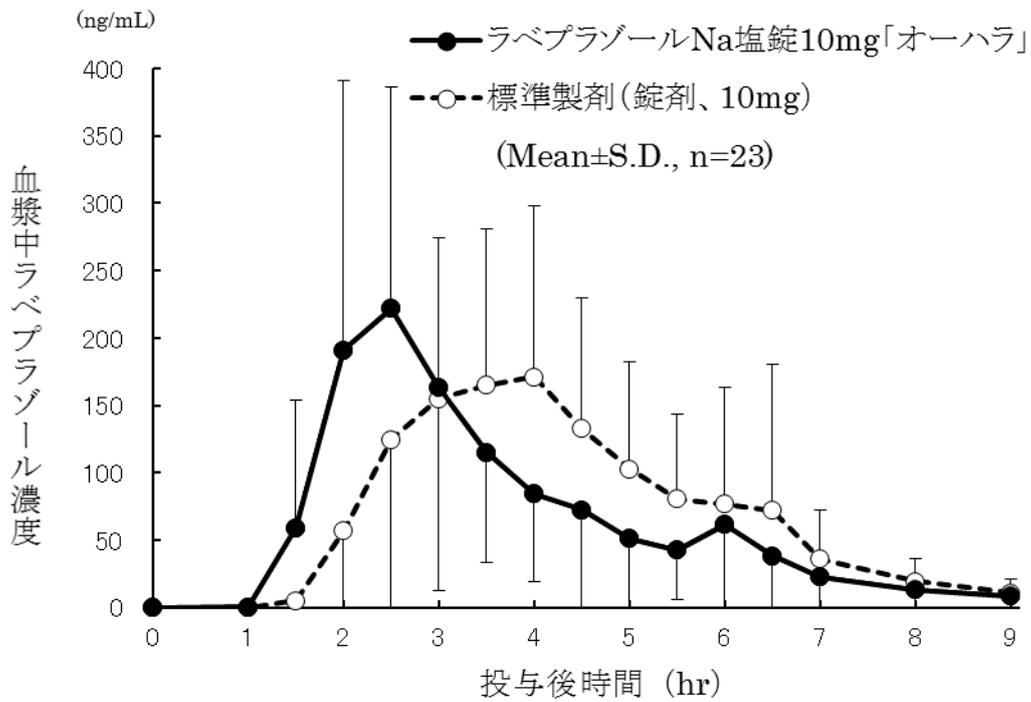
測定結果に基づき、薬物動態パラメータについて比較検討した結果、同等性評価における判定パラメータである AUC_{0-9} の対数値の平均値の差の 90%信頼区間は、 $\log(0.8594) \sim \log(0.9950)$ 、 C_{max} の対数値の平均値の差の 90%信頼区間は $\log(0.9460) \sim \log(1.2743)$ であり、 AUC_{0-9} は上記ガイドラインの判定基準 [$\log(0.80) \sim \log(1.25)$] を満たしているものの、 C_{max} はガイドラインに判定基準を満たさなかった。しかし、平均値の差においては、 AUC_{0-9} は $\log(0.9247)$ 、 C_{max} は $\log(1.0979)$ と上記ガイドラインの判定基準である $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ の範囲内であった。また、ラベプラゾール Na 塩錠 10mg「オーハラ」及び標準製剤の溶出挙動は、類似していると判定されている。

一方、参考パラメータの一つである t_{max} において薬剤間に有意差 ($p < 0.05$) が認められた。しかし、本薬剤の用法・用量が 1 日 1 回であることから、ラベプラゾール Na 塩錠 10mg「オーハラ」と標準製剤の t_{max} の差（0.6 時間）が臨床効果の発現に影響するとは考えられないと判断した。

なお、その他の参考パラメータについては、いずれも薬剤間に有意差 ($p < 0.05$) は認められなかった。

従って、両製剤について差は認められず、生物学的に同等であると判断した。

なお、1 例が第 II 期投与前に自己都合により中止となったため、23 例を生物学的同等性評価の対象とした。



血漿中ラベプラゾール濃度の推移

薬物動態パラメータ

	AUC ₀₋₉ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)	Kel (hr ⁻¹)
ラベプラゾールNa塩錠10mg「オーハラ」	585.57±288.24	352.48±130.93	2.7±1.2	1.5±0.7	0.53±0.19
標準製剤(錠剤、10mg)	624.43±268.39	323.45±110.63	3.7±1.2	1.2±0.5	0.64±0.19

(Mean±S.D., n=23)