

日本薬局方ニセルゴリン錠

ニセルゴリン錠 5mg「日新」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

ニセルゴリン錠 5mg「日新」と標準製剤を、2 剤 2 期のクロスオーバー法によりそれぞれ 4 錠（ニセルゴリンとして 20mg）健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中主代謝物（MDL）濃度を測定し、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、生物学的同等性に関する試験基準*の判定基準に適合し、両製剤の生物学的同等性が確認された。

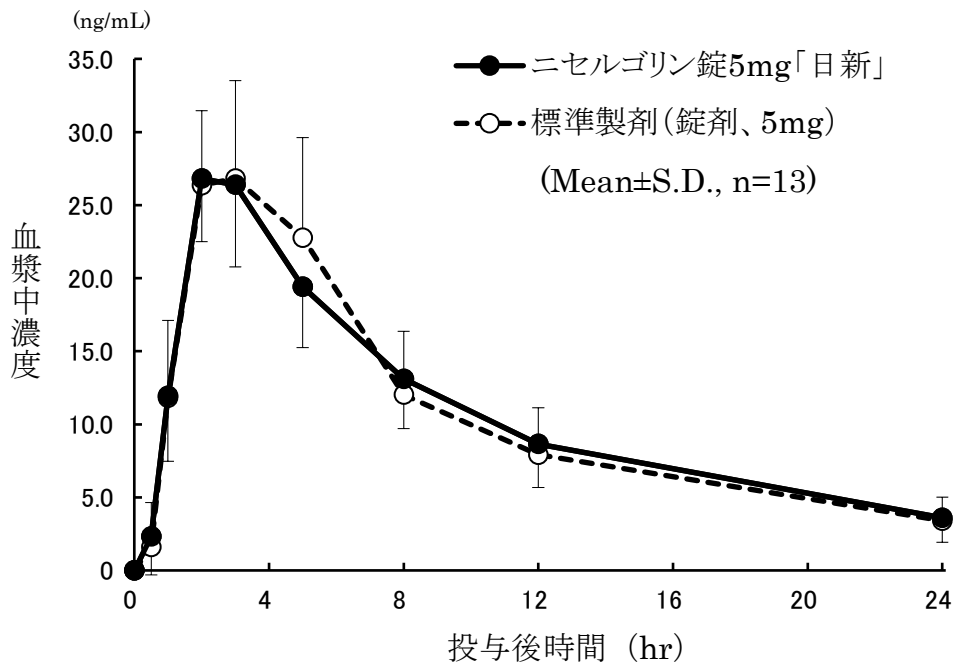
※：生物学的同等性に関する試験基準：昭和 55 年 5 月 30 日付薬審第 718 号

1. 血漿中濃度比較試験

健康成人男子 13 名に、ニセルゴリン錠 5mg「日新」及び標準製剤（錠剤、ニセルゴリンとして 5mg）を、それぞれ 4 錠（ニセルゴリンとして 20mg）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主代謝物である MDL*の血漿中濃度を比較検討した。

その結果、主代謝物である MDL の平均血漿中濃度推移は以下に示したとおりで、平均最高血漿中濃度到達時間 T_{max} はソクワール錠 5mg、標準製剤ともに 2.46 時間で、平均最高血漿中濃度 C_{max} はそれぞれ 28.51ng/mL、28.63ng/mL、消失半減期 $t_{1/2}$ はそれぞれ 7.39 時間、7.27 時間と算出された。

得られた薬物動態パラメータ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。

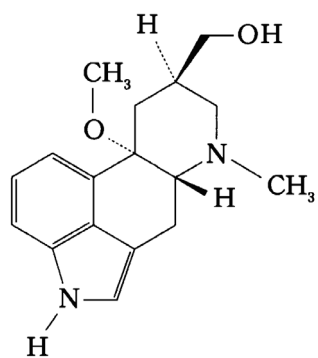


血漿中主代謝物（MDL）濃度推移

薬物動態パラメータ

薬剤名	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)	Kel (hr ⁻¹)
ニセルゴリン錠 5mg「日新」	261.70±50.89	28.51±4.56	2.46±0.52	7.39±1.55	0.10±0.03
標準製剤（錠剤、5mg）	248.85±46.57	28.63±5.40	2.46±0.52	7.27±1.64	0.10±0.03

(Mean±S.D., n=13)



※ : MDL : 10-methoxy-6-methylergoline-8 β -methanol