

日本薬局方バルサルタン錠

バルサルタン錠 80mg 「DSEP」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】

バルサルタン錠 80mg 「DSEP」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ1錠（バルサルタンとして 80mg）、健康成人に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）について統計解析を行った結果、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。

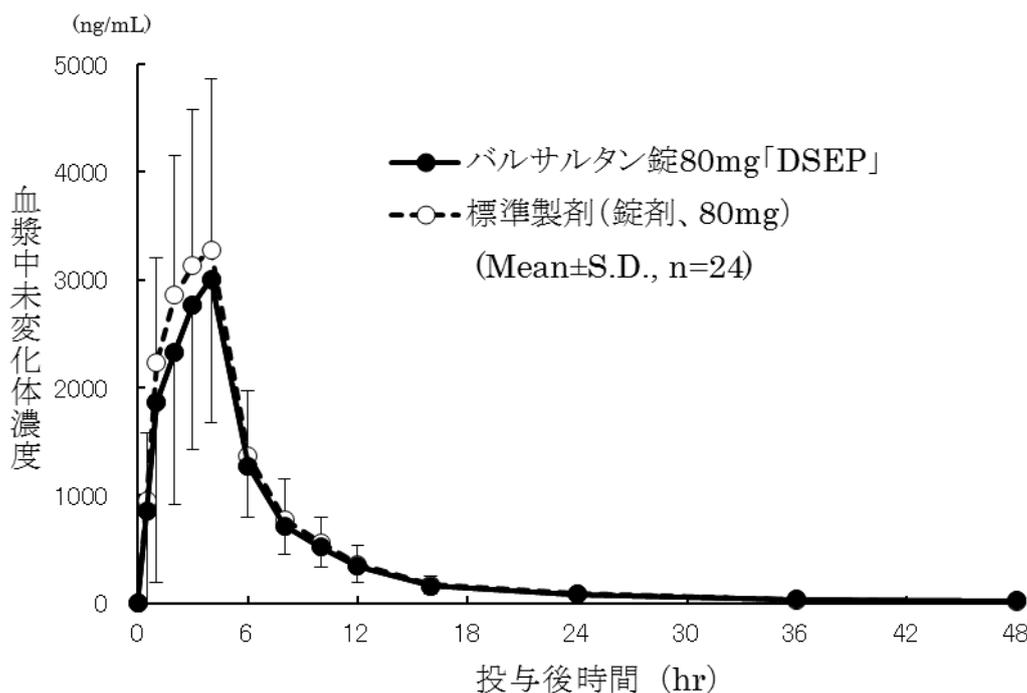
※：生物学的同等性試験ガイドライン：平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号

血漿中濃度比較試験

バルサルタン錠 80mg 「DSEP」と標準製剤を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（バルサルタンとして 80mg）、水 150mL〕、採取した血漿中の未変化体濃度を LC/MS/MS 法により測定した。

測定結果に基づき、AUC 及び C_{max} の常用対数値について、それぞれの平均値の差の 90%信頼区間を求めたところ、AUC では $\log(0.8238) \sim \log(1.0213)$ であり同等性の判定基準である $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であったが、 C_{max} では $\log(0.7882) \sim \log(1.0708)$ であり判定基準を満たしていなかった。

しかしながら、被験者数は 20 名以上であり、 AUC_{0-48} 、 C_{max} の対数値の平均値の差は、それぞれ $\log(0.9172)$ 、 $\log(0.9187)$ であり、 $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ の範囲にあること、かつ、溶出試験において溶出挙動が類似していると判定されているため、両製剤は生物学的に同等であると判断した。



血漿中未変化体濃度推移

血漿中バルサルタンの薬物動態パラメータ

	AUC ₀₋₄₈ (ng·hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)	Kel (hr ⁻¹)
バルサルタン錠 80mg 「DSEP」	19870 ± 7928	3418 ± 1559	3.13 ± 1.08	11.21 ± 5.01	0.0713 ± 0.0239
標準製剤 (錠剤、80mg)	21900 ± 8980	3643 ± 1421	2.75 ± 1.22	9.63 ± 4.41	0.0809 ± 0.0231

(Mean ± S.D., n=24)

VAS80TBE1912