

日本薬局方アロプリノール錠

アロプリノール錠 50mg「NS」の 生物学的同等性に関する資料

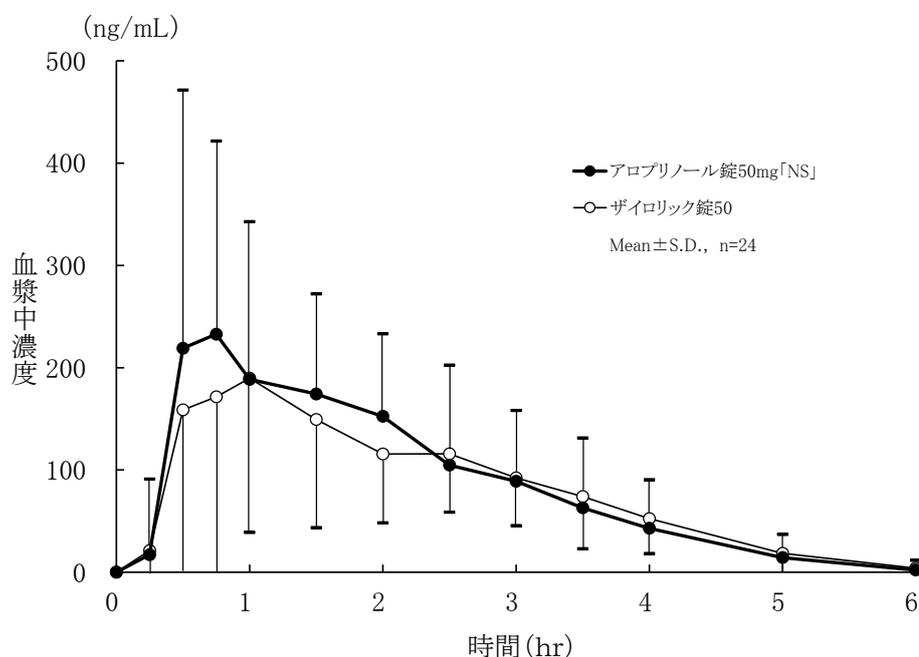
第一三共エスファ株式会社

血漿中濃度比較試験

健康成人男子 24 名に、アロプリノール錠 50mg 「NS」及びザイロリック錠 50 を、それぞれ 1 錠（アロプリノールとして 50mg）絶食時単回経口投与し、6 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、アロプリノール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} はアロプリノール錠 50mg 「NS」が 1.240 時間、ザイロリック錠 50 が 1.531 時間で、最高血漿中濃度 C_{max} はそれぞれ 378.16ng/mL、347.66ng/mL、消失半減期 $T_{1/2}$ はそれぞれ 0.801 時間、0.793 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、0～6 時間までの血漿中濃度-時間曲線下面積 AUC_{0-6} は $\log(0.9856) \sim \log(1.2142)$ 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 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であった。 C_{max} は $\log(0.8609) \sim \log(1.3686)$ であり、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲外であったが、対数変換値の平均値の差が $\log(1.0855)$ で、 $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ の範囲内であり、且つ、溶出性について溶出挙動が類似していると判定され、後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインの基準に適合した。



薬剤名	血漿中濃度 (ng/mL)														AUC_{0-6} (ng·hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
	0hr	0.25hr	0.5hr	0.75hr	1hr	1.5hr	2hr	2.5hr	3hr	3.5hr	4hr	5hr	6hr					
アロプリノール錠50mg「NS」	0.00	17.22	218.98	232.70	188.56	174.25	152.38	104.79	88.99	62.95	42.95	14.33	2.15	527.2	378.16	1.240	0.801	
±S.D.	-	33.45	252.43	188.90	149.74	97.88	80.67	46.04	43.49	40.02	24.62	14.86	5.90	152.7	190.64	0.858	0.115	
ザイロリック錠50	0.00	21.18	158.73	171.48	189.64	149.31	115.61	115.74	92.25	74.01	52.52	18.44	4.00	492.2	347.66	1.531	0.793	
±S.D.	-	69.98	239.86	202.27	153.06	105.67	67.37	86.77	65.98	57.19	38.01	18.54	7.61	171.0	165.18	1.046	0.122	

(n=24)