

プロピペリン塩酸塩錠の生物学的同等性に関わる資料

ニプロESファーマ株式会社

プロピペリン塩酸塩錠 10mg「タナベ」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(1997年12月22日医薬審第487号)に従って、プロピペリン塩酸塩錠 10mg「タナベ」(試験製剤)と標準製剤をそれぞれ1錠(プロピペリン塩酸塩として10mg)、クロスオーバー法により健康成人男性(n=19)に絶食時単回経口投与して、投与前(0時間)～投与後36時間、計11時点の血漿中未変化体および活性代謝物(プロピペリンN-オキシド)濃度をGC-MSにより測定した(下図、定量限界;未変化体:0.50 ng/mL, 代謝物:1.00 ng/mL)。得られた濃度値から下表に示す如く薬物動態学的パラメータを算出した。

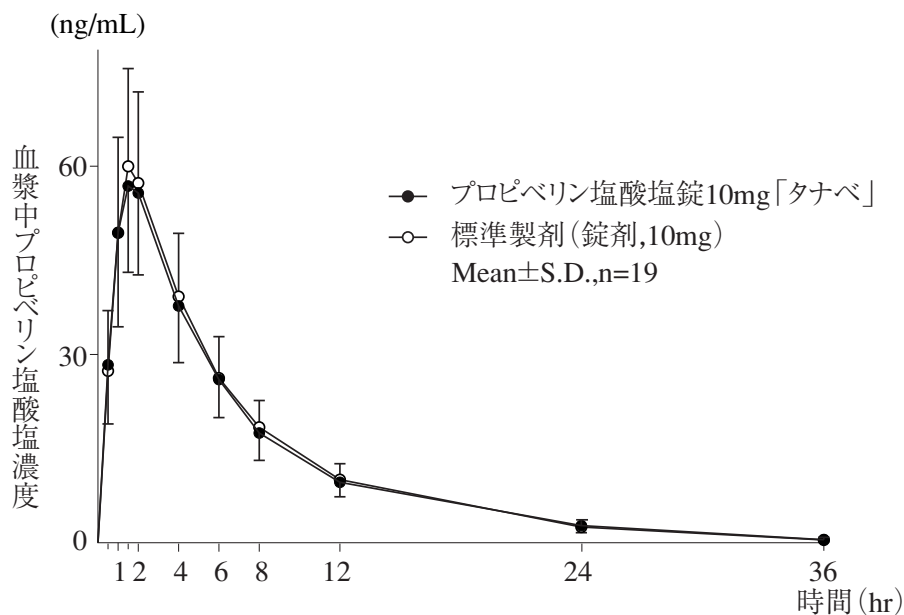
両剤のC_{max}およびAUC₀₋₃₆の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、未変化体でそれぞれ、log(0.905)～log(1.060)およびlog(0.909)～log(1.064)、代謝物でそれぞれ、log(0.938)～log(1.043)およびlog(0.961)～log(1.038)であり、いずれもガイドラインの基準であるlog(0.8)～log(1.25)の範囲内であった。

以上の結果より、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

<プロピペリン塩酸塩錠 10mg「タナベ」>(Mean±S.D., n=19)

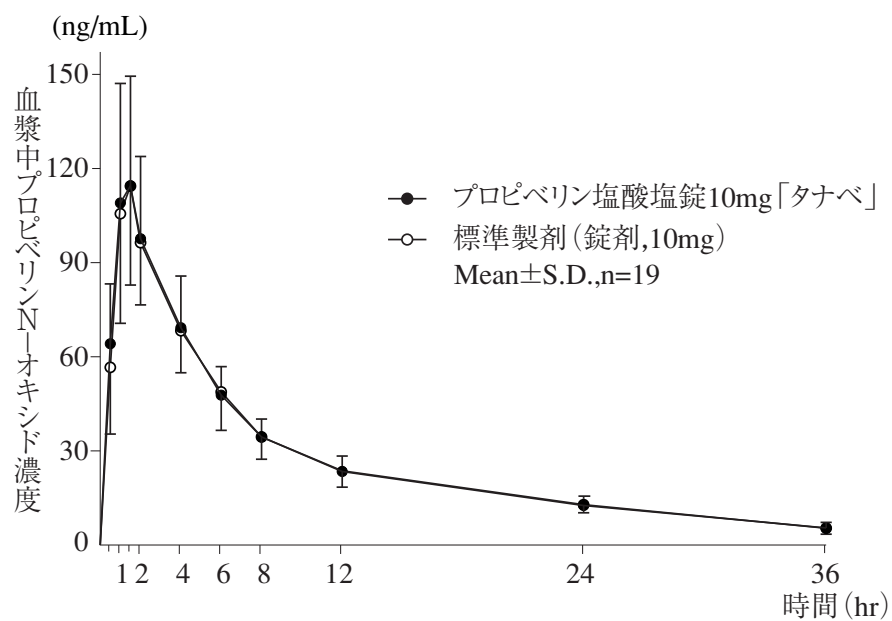
【 未変化体 】

	プロピペリン塩酸塩錠 10mg「タナベ」	標準製剤
C _{max} (ng/mL)	60.18±14.55	61.54±14.51
AUC ₀₋₃₆ (ng·hr/mL)	429.57±89.26	439.24±101.73
AUC _{0-∞} (ng·hr/mL)	435.37±89.77	443.99±102.24
T _{max} (hr)	1.55±0.33	1.55±0.28
t _{1/2} (hr)	5.97±0.84	5.60±0.77
kel(hr ⁻¹)	0.1184±0.0177	0.1264±0.0190



【 活性代謝物 】

	プロピペリン塩酸塩錠 10mg 「タナベ」	標準製剤
C _{max} (ng/mL)	117.65±36.94	117.75±32.39
AUC ₀₋₃₆ (ng・hr/mL)	973.85±210.34	971.87±189.74
AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)	1063.06±233.53	1061.02±219.64
T _{max} (hr)	1.34±0.29	1.47±0.31
t _{1/2} (hr)	10.86±1.45	10.76±1.70
kel(hr ⁻¹)	0.0650±0.0094	0.0659±0.0100



プロピペリン塩酸塩錠 20mg「タナベ」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(1997年12月22日医薬審第487号)に従って、プロピペリン塩酸塩錠 20mg「タナベ」(試験製剤)と標準製剤をそれぞれ1錠(プロピペリン塩酸塩として20mg)、クロスオーバー法により健康成人男性(n=20)に絶食時単回経口投与して、投与前(0時間)～投与後72時間、計13時点の血漿中未変化体および活性代謝物(プロピペリンN-オキシド)濃度をGC-MSにより測定した(下図、定量限界:未変化体:0.50 ng/mL, 代謝物:1.00 ng/mL)。得られた濃度値から下表に示す如く薬物動態学的パラメータを算出した。

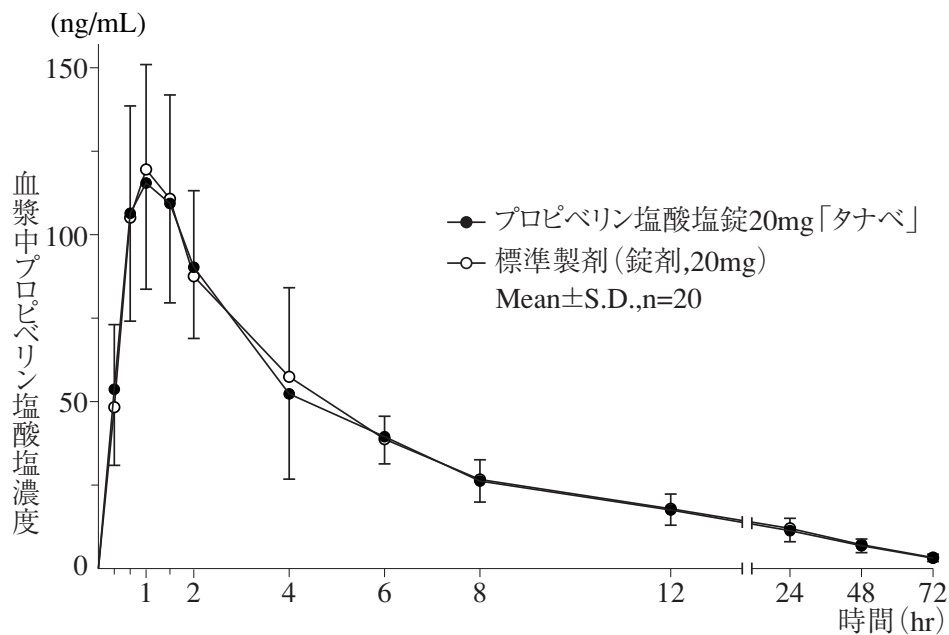
両剤のC_{max}およびAUC₀₋₇₂の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、未変化体でそれぞれ、log(0.949)～log(1.068)およびlog(0.922)～log(1.048)、代謝物でそれぞれ、log(0.881)～log(1.016)およびlog(0.912)～log(1.004)であり、いずれもガイドラインの基準であるlog(0.8)～log(1.25)の範囲内であった。

以上の結果より、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

<プロピペリン塩酸塩錠 20mg「タナベ」>(Mean±S.D., n=20)

【 未変化体 】

	プロピペリン塩酸塩錠 20mg「タナベ」	標準製剤
C _{max} (ng/mL)	123.27±31.78	122.30±31.32
AUC ₀₋₇₂ (ng·hr/mL)	1090.56±257.27	1107.54±236.45
AUC _{0-∞} (ng·hr/mL)	1209.17±289.01	1233.10±266.17
T _{max} (hr)	1.01±0.33	1.08±0.28
t _{1/2} (hr)	24.95±3.25	25.31±2.87
kel(hr ⁻¹)	0.0282±0.0038	0.0277±0.0031



【 活性代謝物 】

	プロピペリン塩酸塩錠 20mg 「タナベ」	標準製剤
C _{max} (ng/mL)	483.45±105.54	520.61±151.54
AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	4000.92±785.16	4178.55±818.75
AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)	4041.24±785.26	4214.01±821.30
T _{max} (hr)	1.01±0.25	0.96±0.28
t _{1/2} (hr)	11.50±1.68	11.16±0.82
kel(hr ⁻¹)	0.0615±0.0088	0.0624±0.0044

