

**【リスペリドン錠 1 m g「NP」】
生物学的同等性に関する資料**

日本ケミファ株式会社

血漿中濃度測定および統計解析

1) 治験

(1) 被験者の対象及び選択基準

日本人の健康成人男子志願者を対象とした。

(2) 投与条件

被験者20名を1群10名の2群に分け、クロスオーバー法で行った。 期としてA群には試験製剤1錠(リスペリドンとして1mg)を、B群には標準製剤1錠(リスペリドンとして1mg)を10時間以上絶食後、水150mLと共に経口投与した。

期の投薬日より7日間の休薬期間後に、 期の試験としてA群とB群の薬剤を交換して同様に投薬を行った。

ただし、 期終了後にA群の被験者1名が参加を辞退したため、 期はA群9名、B群10名に投薬した。

(3) 採血方法及び採血時間

各採血時間にヘパリンナトリウム加真空採血管を用い、前腕部皮静脈より各7mLを採血した。薬物濃度測定用に採取した血液を4℃、2500 rpm、15分間遠心分離し、得られた血漿を検体とし、測定時まで -20℃以下で凍結保存した。

採血時間は、投与前、投与後 0.5、1、1.5、2、4、6、12、24時間の計9時点とした。

2) 血漿中濃度測定

LC-MS/MS法により血漿中リスペリドン濃度を測定した。

3) 結果及び考察

(1) 血漿中薬物濃度データ

試験製剤と標準製剤の両製剤を経口投与して得られた平均血漿中濃度とその推移を図2-1に示す。

両製剤の血漿中リスペリドン濃度推移は近似していた。

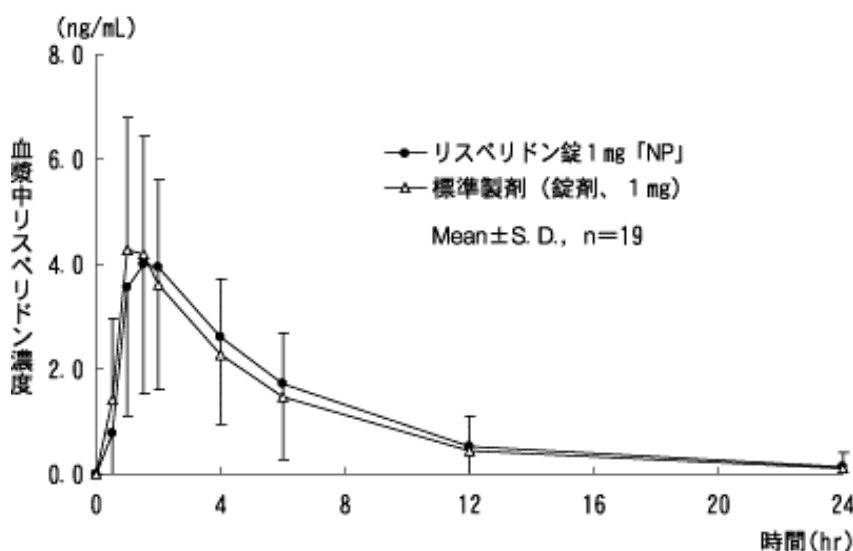


図2-1 健康成人男子にリスペリドンとして1mgを経口投与したときの血漿中リスペリドン濃度推移(Mean ± S.D., n=19)

(2) 薬物動態パラメータ

	AUC _{0-24hr} (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
リスペリドン錠 1mg 「NP」	26.789 ± 20.924	4.609 ± 2.312	1.7 ± 0.7	4.1 ± 2.3
標準製剤 (錠剤, 1mg)	14.480 ± 18.534	4.803 ± 2.479	1.2 ± 0.5	3.6 ± 2.4

(Mean ± S.D., n=19)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) 考察

リスベリドン錠1mg「NP」と標準製剤のそれぞれ1錠(リスベリドンとして1mg)を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に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_{0-24hr} , C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。