

サキサグリプチン錠2.5mg「サワイ」

サキサグリプチン錠2.5mg「サワイ」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号)」に基づき、サキサグリプチン錠5mg「サワイ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等であり、生物学的に同等とみなされた。

なお、サキサグリプチン錠5mg「サワイ」(サキサグリプチン錠2.5mg「サワイ」の標準製剤)と先発医薬品の薬物動態試験の結果は以下のとおりである。

サキサグリプチン錠5mg「サワイ」：生物学的同等性試験(参考)

目的

サキサグリプチン錠5mg「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

方法

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号以下、ガイドラインと記載)に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、サキサグリプチン錠5mg「サワイ」とオングリザ錠5mgをそれぞれ1錠(サキサグリプチンとして5mg)健康成人男性に絶食下单回経口投与し、サキサグリプチンおよびヒドロキシサキサグリプチン(主要活性代謝物)*の血漿中濃度を測定する。

*参考として測定

採血時点	0、0.17、0.33、0.5、0.75、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12、24、36hr
休薬期間	7日間以上
測定方法	LC/MS法
試験製剤	サキサグリプチン錠5mg「サワイ」(ロット番号:786T2S5113)
標準製剤	オングリザ錠5mg(ロット番号:21604B)

評価

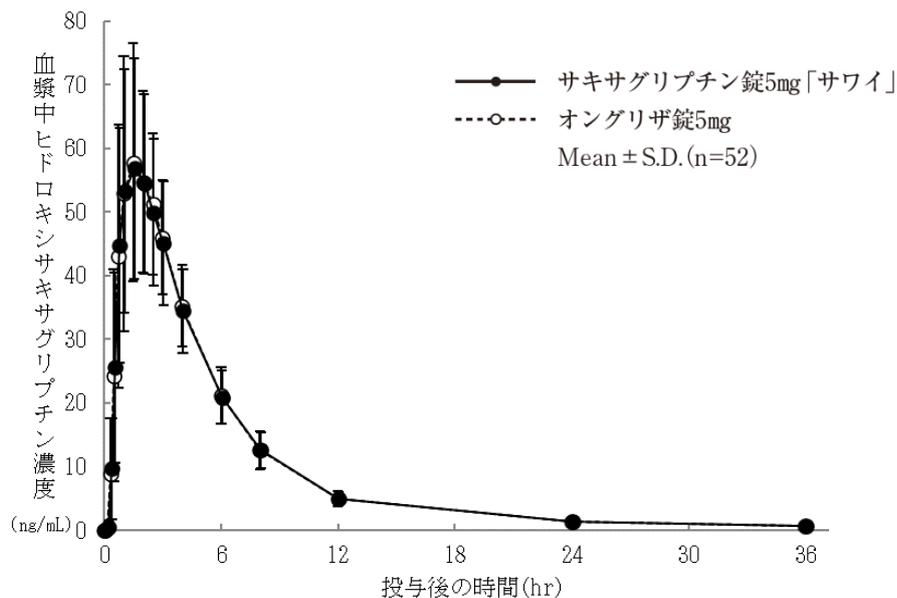
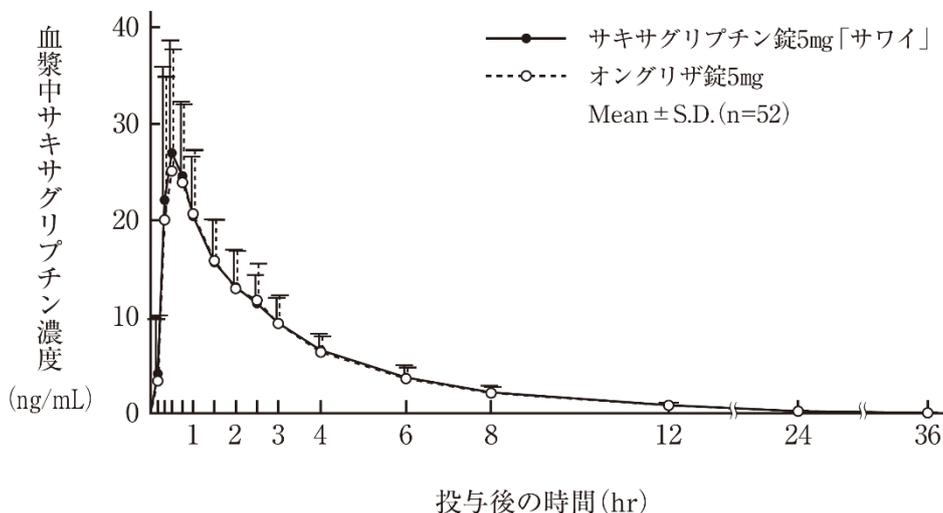
サキサグリプチンについて、ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUC_tおよびC_{max}の対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれlog(0.80)~log(1.25)の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

結果

各製剤 1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-36hr} (ng・hr/mL)
サキサグリブチン	サキサグリブチン錠 5mg「サワイ」	31.2±9.7	0.8±0.9	5.9±1.3	84.0±16.7
	オングリザ錠 5mg	30.6±9.7	0.8±0.5	5.7±1.3	82.1±15.8
サキサグリブチン ヒドロキシ	サキサグリブチン錠 5mg「サワイ」	62.182± 15.102	1.47±0.81	8.31±0.63	342.769± 51.167
	オングリザ錠 5mg	64.375± 14.776	1.59±0.71	8.35±0.58	346.059± 50.708

(Mean ± S.D., n=52)



		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の 90%信頼区間
サキサグリプチン	AUC _{0-36hr}	log (1.02)	log (1.00) ~ log (1.04)
	C _{max}	log (1.02)	log (0.95) ~ log (1.09)

血漿中濃度ならびにAUC_t、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。

結論

サキサグリプチンについて、得られた薬物動態パラメータ(AUC_t、C_{max})の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準であるlog (0.80) ~ log (1.25)の範囲内であったことから、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。

また、参考として測定したヒドロキシサキサグリプチン濃度について、試験製剤と標準製剤で同様の推移を示した。