

レボフロキサシン錠500mg「ZE」の生物学的同等性試験に関する資料

全星薬品工業株式会社  
医 薬 情 報 部

1. 被験薬剤

試験製剤：レボフロキサシン錠500mg「ZE」

標準製剤：クラビット錠500mg

[両薬剤とも1錠中に、レボフロキサシン水和物として512.5mg(レボフロキサシンとして500mg)を含有する。]

2. 被験者及び薬剤投与方法

健康成人男子20名を2群(I群10名、II群10名)に分け、クロスオーバー法に従い試験製剤及び標準製剤を絶食条件下でそれぞれ1錠(レボフロキサシンとして500mg)水とともに経口投与した。

3. レボフロキサシン(未変化体)の血漿中濃度測定

前腕部皮静脈より採血し遠心分離より得た血漿について、レボフロキサシンをLC/MS/MS法により測定した。

4. 測定結果

薬剤投与後のレボフロキサシンの薬物動態パラメータAUC、Cmax、Tmax及び $t_{1/2}$ の平均値を表1に、平均血漿中濃度推移を図1に示した。また、両製剤のCmax及びAUC<sub>(0→24)</sub>対数変換値の平均値の差の90%信頼区間を表2に示した。

表1 薬物動態パラメータ(平均値±標準偏差、n=20)

	AUC <sub>(0→24)</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
試験製剤	48.02±6.59	5.84±1.30	1.3±0.9	7.0±0.8
標準製剤	47.44±5.96	6.25±1.40	1.4±0.4	7.0±0.7

表2 標準製剤と試験製剤の平均値の差の90%信頼区間

パラメータ	対数変換値の平均値の差の90%信頼区間
Cmax	$\log(0.86) \sim \log(1.02)$
AUC <sub>(0→24)</sub>	$\log(1.00) \sim \log(1.03)$

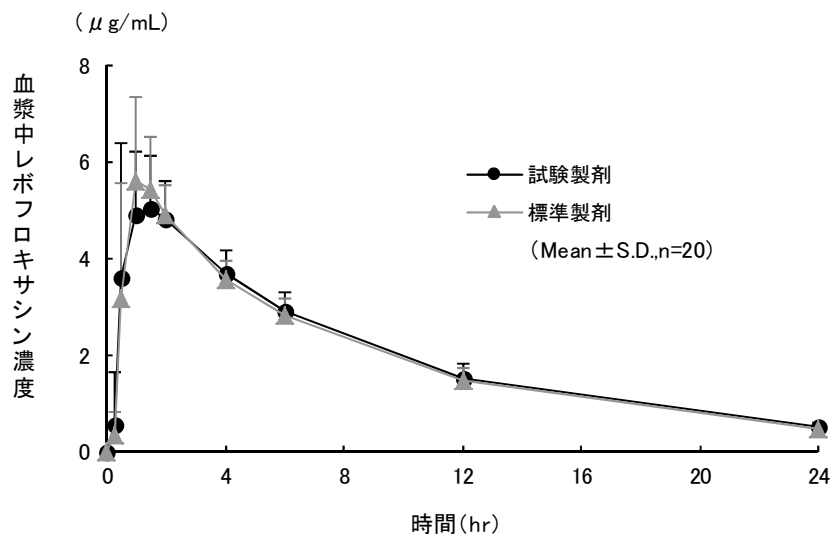


図1 薬剤投与後の平均血漿中濃度推移

## 5. 結論

上記の結果を「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(医薬審発第487号 平成9年12月22日、薬食審査発0229第10号一部改正 平成24年2月29日)」に従い評価したところ、レボフロキサシン錠500mg「ZE」とクラビット錠500mgは絶食単回経口投与において薬物動態パラメータC<sub>max</sub>及びAUC<sub>(0→24)</sub>の対数変換値の平均値の差の90%信頼区間が判定基準範囲内(log(0.80)~log(1.25))であることより、生物学的に同等であると判定した。