

## リュープロレリン酢酸塩注射用キット1.88mg「NP」の血中濃度に関する資料

ニプロ株式会社

リュープロレリン酢酸塩注射用キット1.88mg「NP」のヒトにおける薬物動態を検討する目的で、リュープロレリン酢酸塩注射用キット1.88mg「NP」及び標準製剤(リュープロレリン酢酸塩注射剤)1.88mgを単回皮下投与し、血漿中リュープロレリン(未変化体)濃度を測定した。

### I. 試料

試験製剤: リュープロレリン酢酸塩注射用キット1.88mg「NP」[1容器中にリュープロレリン酢酸塩1.88mgを含有](製造番号: LRK1.88-I01、製造場所: ニプロファーマ株式会社)

標準製剤: リュープロレリン酢酸塩注射剤、1.88mg[1容器中にリュープロレリン酢酸塩1.88mgを含有](製造番号: H080)

### II. 試験

#### 1) 治験の実施

被験者	日本人の閉経後健康成人女性志願者 (n=24)
試験製剤	リュープロレリン酢酸塩注射用キット1.88mg「NP」: 1容器(試験製剤1.88mg)
標準製剤	リュープロレリン酢酸塩注射剤、1.88mg: 1容器(標準製剤1.88mg)
投与量	リュープロレリン酢酸塩として1.88mg
投与条件	クロスオーバー法(休薬期間: 8週間) 10時間以上絶食後、単回皮下投与した。投与後4時間まで絶飲食とした。
採血時間	0(投与前)、0.5、1、2、3、6、24、48、168、336、504、672、1008 hr(13時点)
測定対象物質	リュープロレリン(未変化体)
測定方法	LC/MS/MS法

#### 2) 結果

試験製剤1.88mg及び標準製剤1.88mgを単回皮下投与したときの未変化体の血漿中濃度を図1に、薬物動態パラメータ値を表1に示した。両製剤の血漿中未変化体濃度は投与後1008hrまで同様に推移した。試験製剤1.88mg及び標準製剤1.88mgのT<sub>max</sub>はそれぞれ1.3hr及び1.5hr、C<sub>max</sub>はいずれも約4ng/mLであった。

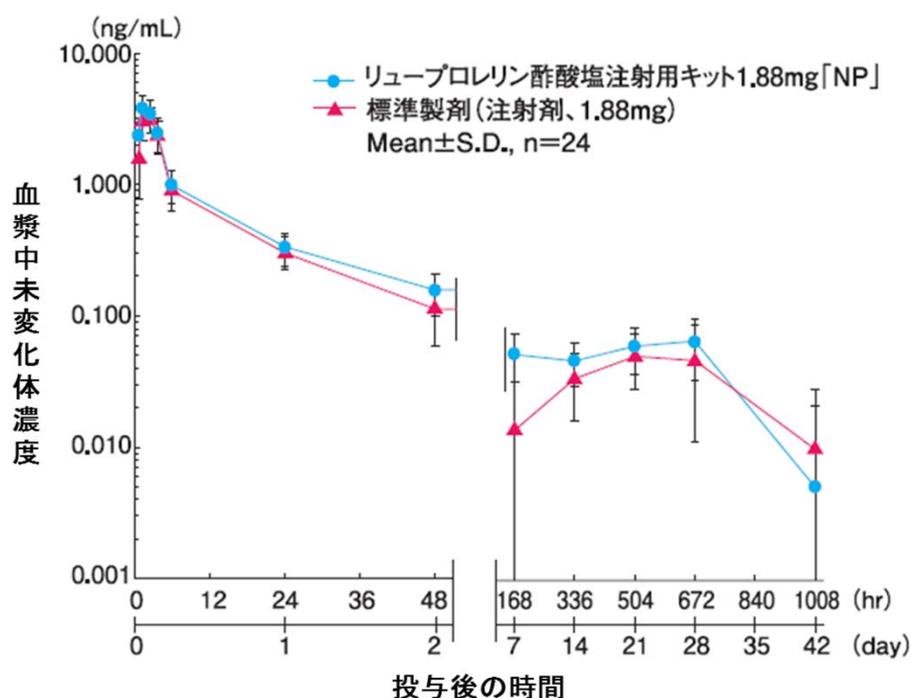


図1. 血漿中未変化体濃度推移

表1. 薬物動態パラメータ

	薬物動態パラメータ				
	Cmax (ng/mL)	AUC <sub>0→42day</sub> (ng·hr/mL)	AUC <sub>0→7day</sub> (ng·hr/mL)	AUC <sub>7→28day</sub> (ng·hr/mL)	Tmax (hr)
試験製剤1.88mg	3.980 ±0.967	83.252 ±20.859	44.304 ±10.597	27.398 ±9.382	1.3 ±0.5
標準製剤1.88mg	3.547 ±0.853	65.819 ±21.007	36.724 ±10.193	19.415 ±9.014	1.5 ±0.5

(Mean±S.D., n=24)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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

リュープロレリン酢酸塩注射用キット1.88mg「NP」及び標準製剤1.88mgを閉経後健康成人女性に単回皮下投与したとき、両製剤の血漿中未変化体濃度は同様に推移し、両製剤は同等と判断された。