

リュープロレリン酢酸塩注射用キット3.75mg「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3.75mg「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3.75mg「NP」及び標準製剤(リュープロレリン酢酸塩注射剤)3.75mg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3.75mg「NP」[1容器中にリュープロレリン酢酸塩3.75mgを含有](製造番号: LRK3.75-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、3.75mg[1容器中にリュープロレリン酢酸塩3.75mgを含有](製造番号: H339)

II. 試験

1) 試験の実施

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3.75mg「NP」: 1容器(試験製剤3.75mg)
標準製剤	リュープロレリン酢酸塩注射剤、3.75mg: 1容器(標準製剤3.75mg)
投与量	リュープロレリン酢酸塩として3.75mg
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3.75mg及び標準製剤3.75mg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。両製剤ともにTmaxは1.5hr、Cmaxは約8ng/mLであった。

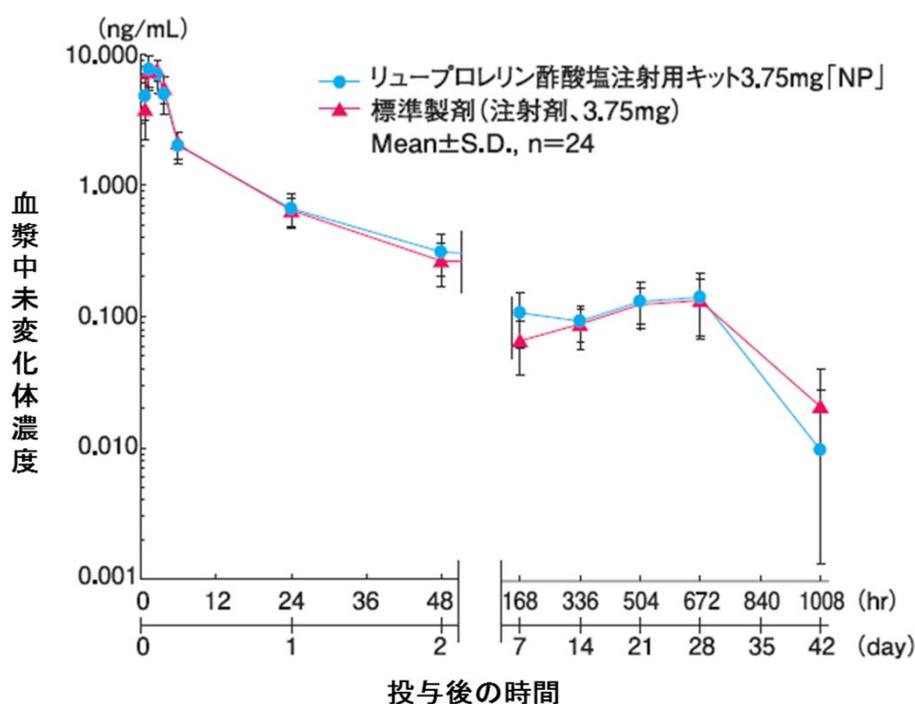


図1. 血漿中未変化体濃度推移

表1. 薬物動態パラメータ

	薬物動態パラメータ				
	Cmax (ng/mL)	AUC _{0→42day} (ng·hr/mL)	AUC _{0→7day} (ng·hr/mL)	AUC _{7→28day} (ng·hr/mL)	Tmax (hr)
試験製剤3.75mg	8.005 ±1.503	178.671 ±43.677	90.030 ±18.294	61.887 ±19.284	1.5 ±0.5
標準製剤3.75mg	8.154 ±1.524	166.607 ±35.654	83.657 ±15.119	55.496 ±15.739	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3.75mg「NP」及び標準製剤3.75mg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、両製剤は同等であると判断された。