エナラプリルマレイン酸塩錠2.5mg、5mg、10mg「フソー」
生物学的同等性試験に関する資料

販　売　元：扶桑薬品工業株式会社

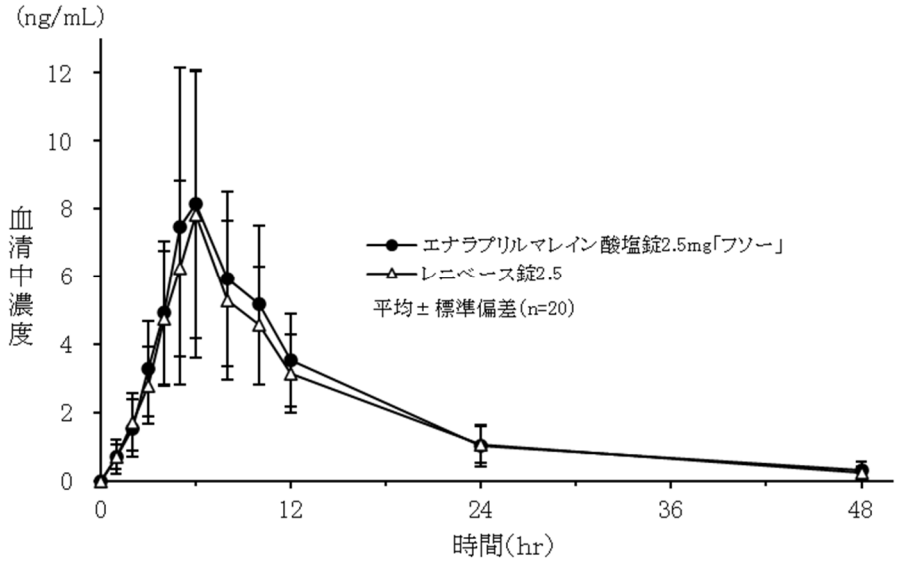
製造販売元：ダイト株式会社

2025年9月改訂

エナラプリルマレイン酸塩錠 2.5mg、5mg、10mg「フソー」
生物学的同等性試験に関する資料

(1)　エナラプリルマレイン酸塩錠 2.5mg「フソー」

エナラプリルマレイン酸塩錠 2.5mg「フソー」とレニベース錠 2.5 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（エナラプリルマレイン酸塩として 2.5mg）を健康成人男性に絶食時に単回経口投与して血清中活性代謝物ジアシド体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（Cmax、AUC）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～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。



製剤名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	Cmax (ng/mL)	AUC (ng･hr/mL)	tmax（hr）	$t_{1/2}$(hr)
エナラプリルマレイン酸塩錠 2.5mg「フソー」	9.19±5.15	98.85±40.53	6.2±1.2	10.8±3.3
レニベース錠 2.5	8.01±4.09	91.19±31.26	6.1±1.0	10.2±4.0

（平均±標準偏差、n=20）

統計解析

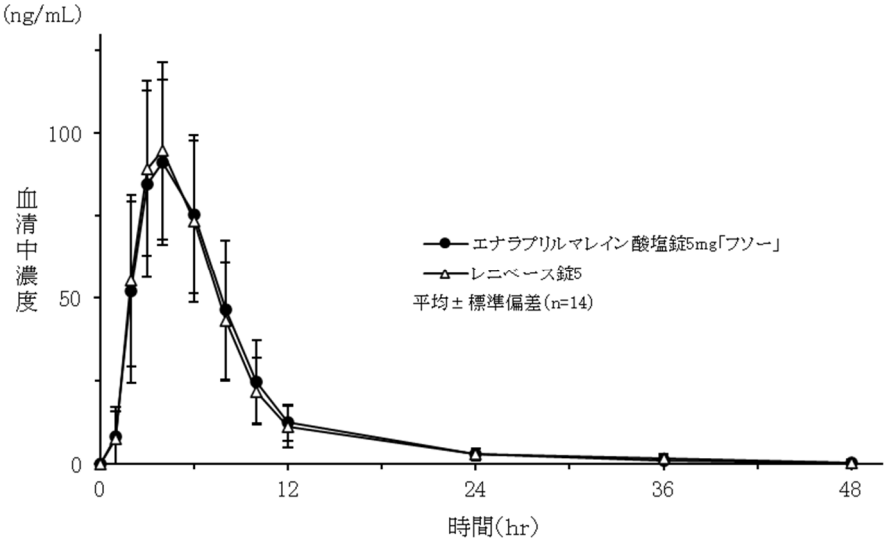
パラメータ	Cmax	$AUC_{0\text{-}48}$	判定基準
90%信頼区間	1.004～1.223	0.947～1.181	0.8～1.25

血清中濃度並びにCmax、AUC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。

2025 年 9 月改訂

(2)　エナラプリルマレイン酸塩錠 5mg「フソー」

エナラプリルマレイン酸塩錠 5mg「フソー」とレニベース錠 5 を、クロスオーバー法によりそれぞれ２錠（エナラプリルマレイン酸塩として 10mg）を健康成人男性に絶食時に単回経口投与して血清中活性代謝物ジアシド体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（Cmax、AUC）について分散分析にて統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。



製剤名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	Cmax (ng/mL)	AUC (ng･hr/mL)	tmax（hr）	$t_{1/2}$(hr)
エナラプリルマレイン酸塩錠 5 ㎎「フソー」	92.79±24.61	710.7±224.3	3.9±0.8	10.7±12.4
レニベース錠 5	96.31±26.81	706.6±222.8	3.5±0.5	12.8±13.4

（平均±標準偏差、n=14）

統計解析

変動要因	分　散　比		判定基準
	Cmax	$AUC_{0\text{-}48}$	
被験者間変動	12.830	8.349	2.131
群又は持込効果	0.789	0.938	3.177
被験者／群	13.041	8.389	2.147
被験者内変動			
時　　期	0.385	0.070	3.177
薬　　剤	0.900	0.011	3.177
95%信頼区間	-10.5%～3.2%	-9.3%～10.5%	-20%～20%
最小検出差	0.116	0.168	≦0.200
検出力	99.8%	91.6%	≧80%
最小N数	4 名	6 名	≦7 名

血清中濃度並びにCmax、AUC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。

2025 年 9 月改訂

(3)　エナラプリルマレイン酸塩錠 10mg「フソー」

エナラプリルマレイン酸塩錠 10mg「フソー」はエナラプリルマレイン酸塩錠 5mg「フソー」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「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（平成 12 年 2 月 14 日医薬審第 64 号、平成 18 年 11 月 24 日一部改正）」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

試験ガイドライン：「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（平成 12 年 2 月 14 日医薬審第 64 号、平成 18 年 11 月 24 日一部改正）」
試験方法：溶出試験法第 2 法（パドル法）
標準製剤：エナラプリルマレイン酸塩錠 5mg「フソー」
試験液量：900mL
試験液：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水
回転数：50rpm、100rpm

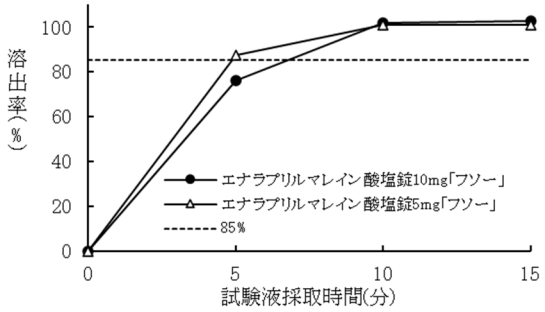
1）平均溶出率

回転数	試験液	判定時点	溶出率（%）		判定基準	判定
			標準製剤	試験製剤		
50rpm	pH1.2	15 分	100.9	102.6	85%以上	適合
	pH3.0	15 分	101.8	102.5	85%以上	適合
	pH6.8	15 分	101.3	102.5	85%以上	適合
	水	15 分	99.7	102.8	85%以上	適合
100rpm	pH3.0	15 分	101.9	101.7	85%以上	適合

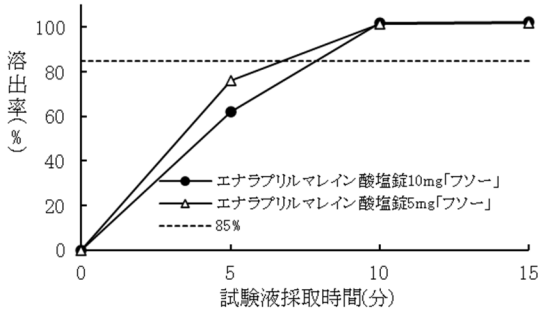
2）個々の溶出率

回転数	試験液	判定時点	標準製剤（%）	試験製剤（%）				判定
				平均値	最大値 最小値	最大差		
50rpm	pH1.2	15 分	100.9	102.6	106.0 99.4	3.4	±15%超が 1 個以下 ±25%超なし	適合
	pH3.0	15 分	101.8	102.5	105.5 99.6	3.0	±15%超が 1 個以下 ±25%超なし	適合
	pH6.8	15 分	101.3	102.5	106.9 99.7	4.4	±15%超が 1 個以下 ±25%超なし	適合
	水	15 分	99.7	102.8	105.1 99.4	3.4	±15%超が 1 個以下 ±25%超なし	適合
100rpm	pH3.0	15 分	101.9	101.7	103.1 98.8	2.9	±15%超が 1 個以下 ±25%超なし	適合

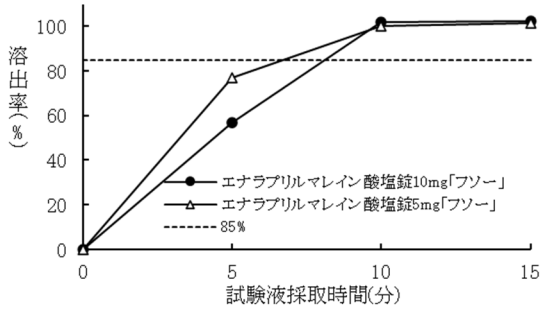
溶出試験結果(pH1.2／50rpm)



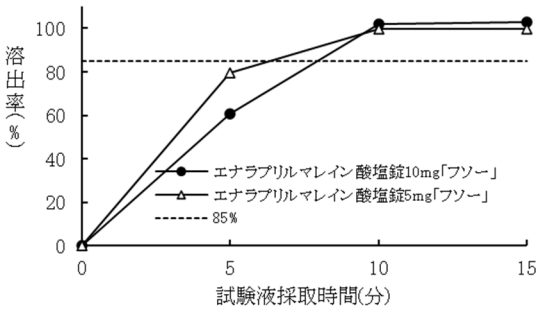
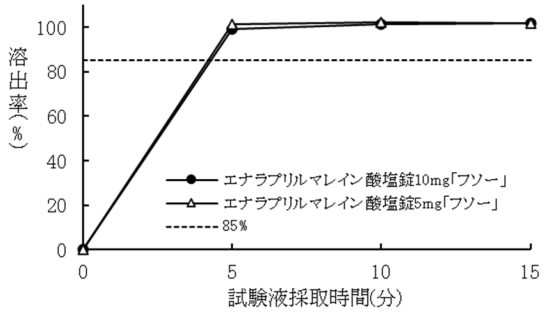
溶出試験結果(pH3.0／50rpm)



溶出試験結果(pH6.8／50rpm)



溶出試験結果(水／50rpm)



溶出試験結果(pH3.0／100rpm)