



Pharmacokinetics and Safety of Ciclesonide and its Active Metabolite of Ciclesonide Inhalation Powder in Healthy Chinese Subjects

Mengmeng WANG^{1,2}, Liyuan JIANG^{2,3}, Wenjia ZHOU¹, Lu CHENG²,
Shuisheng ZHONG², Xin DONG², Li DING^{2*} & Quanying ZHANG¹

¹ Clinical Pharmacology Laboratory, The Second Affiliated Hospital of Soochow University
Suzhou 215004, China

² Department of Pharmaceutical Analysis, China Pharmaceutical University, Nanjing 210009, China

³ Medical Faculty, Quzhou College of Technology, Quzhou 324000, China

SUMMARY. Ciclesonide (CIC) is an inhaled corticosteroid for the treatment of asthma. The aim of this study was to investigate the pharmacokinetics and safety of CIC and its active metabolite, desisobutyryl ciclesonide (RM1), after administration of CIC inhalation powder in healthy Chinese subjects. CIC inhalation powder was well tolerated. After single-dose administration of 80 ~ 320 µg, the median T_{max} was 5 min for CIC and 2 h for RM1. The C_{max} and AUC of both CIC and RM1 were dose proportional. After consecutive administration of 160 µg, no accumulation was found for CIC while an accumulation of RM1 was found with R_{ac} of 1.6 for AUC. Compared with previous study, the exposure of CIC and RM1 after administration of CIC inhalation powder was similar to inhalation aerosol. The pharmacokinetic profile indicated inhalation powder was a reliable method for controlling the delivered dose of CIC into the systemic circulation.

RESUMEN. La ciclesonida (CIC) es un corticosteroide inhalado para el tratamiento del asma. El objetivo de este estudio fue investigar la farmacocinética y la seguridad de la CIC y de su metabolito activo, ciclesonida desisobutyryl (RM1), después de la administración de CIC en polvo para inhalación en sujetos chinos sanos. El polvo para inhalación de CIC fue bien tolerado. Tras la administración de una dosis única de 80~320 µg, la T_{max} media fue de 5 min para CIC y 2 h para RM1. La C_{max} y el AUC de ambos, CIC y RM1, fueron proporcionales a la dosis. Después de la administración consecutiva de 160 µg, se encontró acumulación para CIC, mientras que una acumulación de RM1 se encontró con R_{ac} de 1.6 para las AUC. En comparación con el estudio anterior, la exposición de los CIC y RM1 después de la administración de la CIC en polvo para inhalación fue similar a la inhalación de aerosoles. El perfil farmacocinético indicado para el polvo para inhalación es un método fiable para controlar la dosis suministrada de CIC en la circulación sistémica.

KEY WORDS: ciclesonide, desisobutyryl ciclesonide, inhaled corticosteroid, inhalation powder, pharmacokinetics

* Author to whom correspondence should be addressed. E-mail: dingligh@sina.com