

## 2.3.S 原薬

### 1. 名称

INN : paliperidone

一般的名称 (JAN) :

(日本名) パリペリドンパルミチン酸エステル

(英名) Paliperidone Palmitate

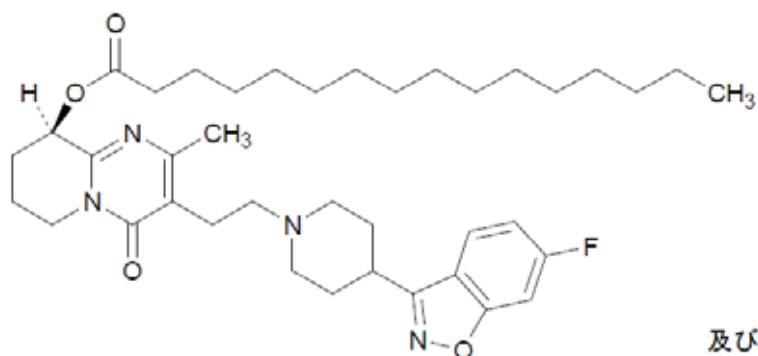
化学名 :

(9*RS*)-3-{2-[4-(6-Fluoro-1,2-benzisoxazol-3-yl)piperidin-1-yl]ethyl}-2-methyl-4-oxo-6,7,8,9-tetrahydro-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin-9-yl palmitate

CAS 登録番号 : 199739-10-1

### 2. 構造

化学構造式 :



分子式 :  $C_{39}H_{57}FN_4O_4$

分子量 : 664.89

### 3. 一般特性

性状 : 白色の粉末

溶解性 :

各種溶媒に対する溶解性	
溶媒	溶解度 (g/100 mL)
ジクロロメタン	33
酢酸エチル	0.28
メタノール	0.035
水	< 0.001

解離定数 :  $pK_{a2} : < 3$  (ピリミジン環部)

分配係数 :  $\text{LogP} : > 5$

\* 新薬承認情報公開時に置き換え

#### 4. 安定性

試験名	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	30°C/65%RH	ポリエチレン袋/ ポリエチレン製ドラム	36 カ月	変化なし
加速試験	40°C/75%RH		6 カ月	変化なし
光安定性試験	曝光 <sup>a)</sup>	ペトリ皿	8 時間	分解物の生成が認められた

試験項目：性状，類縁物質，水分，含量，粒度分布，結晶化度，旋光度

<sup>a)</sup> ICH ガイドライン Q1B, オプション 1

## 2.3.P 製剤

### 1. 剤型及び性状

白色の懸濁性注射剤

### 2. 製剤の組成

販売名		ゼプリオン水懸筋注シリンジ				
		25 mg	50 mg	75 mg	100 mg	150 mg
有効成分の含量 (1 シリンジ中)	パリペリドンパルミチン酸エステル (パリペリドンとして)	39 mg (25 mg)	78 mg (50 mg)	117 mg (75 mg)	156 mg (100 mg)	234 mg (150 mg)
	薬液量 (mL)	0.25	0.5	0.75	1	1.5
添加剤 (1 シリンジ中) (mg)	ポリソルベート 20	3	6	9	12	18
	マクロゴール 4000NF	7.5	15	22.5	30	45
	クエン酸水和物	1.25	2.5	3.75	5	7.5
	無水リン酸一水素ナトリウム	1.25	2.5	3.75	5	7.5
	リン酸二水素ナトリウム一水和物	0.625	1.25	1.875	2.5	3.75
	水酸化ナトリウム	0.71	1.42	2.13	2.84	4.26

### 3. 安定性

試験名	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C/40%RH	シリンジ	24 カ月	変化なし
加速試験	40°C/≤25%RH		6 カ月	一部のロットで放出性の低下が認められたが、その他の項目に変化は認められなかった。
光安定性試験	曝光 <sup>a)</sup>		8 時間	変化なし

試験項目：性状，pH，分解生成物，エンドトキシン（長期保存試験のみ），無菌性（長期保存試験のみ），放出性，粒度分布，含量

<sup>a)</sup> ICH ガイドライン Q1B, オプション 1

\* 新薬承認情報公開時に置き換え