2.3 品質に関する概括資料

2.3.S 原薬

1) 名称

(1) 一般名

－ INN：Asenapine

（r-INN：WHO Drug Information, 2003, Vol. 17, No. 2, List 49, 117 頁）

－ JAN

日本名　アセナピンマレイン酸塩

英　名　Asenapine Maleate

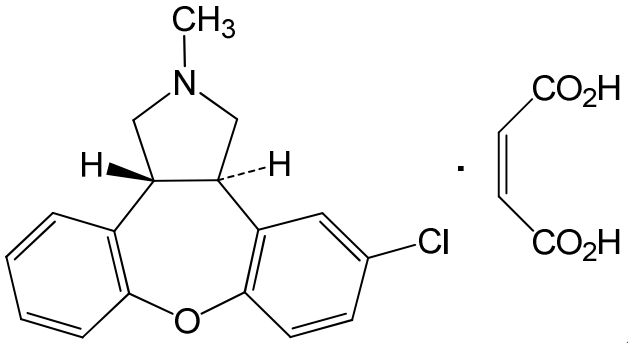
(2) 化学名

日本名　(3a*RS*,12b*RS*)-5-クロロ-2-メチル-2,3,3a,12b-テトラヒドロ-1*H*-ジベンゾ[2,3:6,7]オキセピノ[4,5-*c*]ピロール　一マレイン酸塩

英　名　(3a*RS*,12b*RS*)-5-Chloro-2-methyl-2,3,3a,12b-tetrahydro-1*H*-dibenzo[2,3:6,7]oxepino[4,5-*c*]pyrrole monomaleate

2) 構造

(1) 構造式



及び鏡像異性体

(2) 分子式：$C_{17}H_{16}ClNO \cdot C_4H_4O_4$

(3) 分子量：401.84

3) 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～灰白色の粉末である。

(2) 溶解性

各種溶媒における溶解度

（測定温度：室温*）

溶媒	溶解度 （mg/mL アセナピン）	本品 1 g の溶解に 要する溶媒量（mL）	日本薬局方の表現
水	3.7	192	溶けにくい
エタノール	14	51	やや溶けにくい
アセトン	≧18	≦40	やや溶けにくい

*：温度は管理されていなかった。

※「2.3.S 原薬」の項を新薬情報提供時に置換えた

各種 pH 溶媒に対する溶解度

（測定温度：室温*）

pH	溶解度 （mg/mL アセナピン）	本品 1 g の溶解に 要する溶媒量（mL）	日本薬局方の表現
4.0	3.8	187	溶けにくい
7.0	3.0	237	溶けにくい
10.0	0.010	71,115	ほとんど溶けない

*：温度は管理されていなかった。

(3) 吸湿性

吸湿性を認めない。

(4) 融点

融点：139.9℃

(5) 酸塩基解離定数

pKa：8.6（21.5 ~ 23.8℃）

(6) 分配係数

オクタノール／水分配係数（log Pow）は、4.9（中性）及び 1.4（酸性）であった。（21.5 ~ 23.8℃）

(7) その他の主な示性値

旋光度

$[\alpha]_D^{20}$：-0.2°（10 mg/mL メタノール溶液）

$[\alpha]_D^{25}$：0.0°（10 mg/mL メタノール溶液）

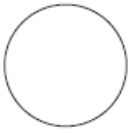
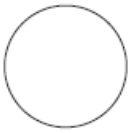
4) 各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	ポリエチレン二重袋	36 箇月	変化なし
加速試験	40°C/75%RH	ポリエチレン二重袋	6 箇月	変化なし
苛酷試験（光）	近紫外光（200 W･hr/m^2）	ポリエチレン袋	-	変化なし
	近紫外光（200 W･hr/m^2） + 白色蛍光灯（125 万 lux･hr）	ポリエチレン袋	-	変化なし

試験項目：色、形状、類縁物質、含量、水分

2.3.P 製剤

1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	性状	外形		
		表	裏	側面
シクレスト舌下錠 5 mg	白色～灰白色の円形錠（凍結乾燥品）			
		直径（mm）	厚さ（mm）	重量（mg）
		約 12	約 3	約 25
シクレスト舌下錠 10 mg	白色～灰白色の円形錠（凍結乾燥品）			
		直径（mm）	厚さ（mm）	重量（mg）
		約 12	約 3	約 31

2) 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

シクレスト舌下錠 5 mg : 1 錠中アセナピンマレイン酸塩 7.03 mg（アセナピンとして 5.00 mg 含有

シクレスト舌下錠 10 mg : 1 錠中アセナピンマレイン酸塩 14.06 mg（アセナピンとして 10.00 mg）含有

(2) 添加物

ゼラチン、D-マンニトール

3) 各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存形態*	保存期間	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	アルミニウムブリスター包装	36 箇月	変化なし
加速試験	40°C/75%RH	アルミニウムブリスター包装	6 箇月	変化なし
苛酷試験（熱）	50°C	アルミニウムブリスター包装	3 箇月	変化なし
苛酷試験（光）	近紫外光（200 W･hr/m^2） + 白色蛍光灯（120 万 lux･hr）	アルミニウムブリスター包装 開放	-	変化なし

試験項目：性状、類縁物質、水分、崩壊性、含量

*：シクレスト舌下錠 5mg 及び 10mg はアルミニウムブリスター包装品である。

※「2.3.P 製剤」の項を新薬情報提供時に置換えた