2.3 品質に関する概括資料

小野薬品工業株式会社

目次

2.3　品質に関する概括資料 3
2.3.S　原薬 4
2.3.P　製剤 6

2.3 品質に関する概括資料

申請製剤の販売名，剤形等は以下のとおりである．

販売名	カイプロリス点滴静注用 10mg，カイプロリス点滴静注用 40mg
原薬の一般名	カルフィルゾミブ
企業名	小野薬品工業株式会社
剤形	注射剤（バイアル）
含量	カルフィルゾミブ 10 mg，カルフィルゾミブ 40 mg
投与経路	静脈内持続投与
適応症	再発又は難治性の多発性骨髄腫

2.3.S 原薬

有効成分に関する理化学的知見

国際一般的名称（INN）	carfilzomib
一般的名称（JAN）	（日本名）カルフィルゾミブ （英名）Carfilzomib
化学名又は本質	（日本名）*N*-{(2*S*)-2-[(モルホリン-4-イルアセチル)アミノ]-4-フェニルブタノイル}-L-ロイシル-L-フェニルアラニン-*N*-{(2*S*)-4-メチル-1-[(2*R*)-2-メチルオキシラン-2-イル]-1-オキソペンタン-2-イル}アミド （英名）*N*-{(2*S*)-2-[(Morpholin-4-ylacetyl)amino]-4-phenylbutanoyl}-L-leucyl-L-phenylalanin-*N*-{(2*S*)-4-methyl-1-[(2*R*)-2-methyloxiran-2-yl]-1-oxopentan-2-yl}amide
分子式	$C_{40}H_{57}N_5O_7$
分子量	719.91
性状	白色～灰白色の固体

2.3 品質に関する概括資料
カルフィルゾミブ

原薬の安定性

	製造方法のオプション	ロット数	保存条件	保存期間	保存形態
長期保存試験	オプション 1	3	5±3℃	36 箇月	2 重ポリエチレン袋／遮光ポリエチレンドラム
	オプション 2	3		36 箇月	
加速試験	オプション 1	3	25±2℃/60±5%RH	6 箇月	
	オプション 2	3			
光安定性試験	オプション 1	1	25±2℃/60±5%RH 総照度 120 万 lx･h 以上及び総近紫外放射エネルギー 200W･h/m^2以上	－	－
・両オプションで製造された原薬は，長期保存試験で，36 箇月間明確な品質の変化は認められなかった. ・両オプションで製造された原薬は，加速試験では，一部の不純物のわずかな増加が認められたが，6 箇月間明確な品質の変化は認められなかった. ・オプション 1 で製造された原薬は，苛酷試験（光）では，純度試験（類縁物質）及び定量法の判定基準を満たさず，光に不安定であった.					

－：該当せず

2.3.P　　製剤

製剤の組成

販売名	カイプロリス点滴静注用 10mg	カイプロリス点滴静注用 40mg
成分・含量 [1)] （1 バイアル中）	カルフィルゾミブ　10mg	カルフィルゾミブ　40mg
添加物 [2)] （1 バイアル中）	スルホブチルエーテル β-シクロデキストリン Na　533mg 無水クエン酸　10.2mg pH 調節剤　適量	スルホブチルエーテル β-シクロデキストリン Na　2130mg 無水クエン酸　40.9mg pH 調節剤　適量
剤形	注射剤（バイアル）	
性状	白色～灰白色の塊又は粉末，凍結乾燥品	

1) 本品は注射液吸引時の損失を考慮して，6.5%過量充てんされているので，実充てん量は各々10.7 mg，42.6 mg である．

2) 過量充てんした実充てん量を示している．

製剤の安定性

光安定性試験の結果，製剤は光に不安定であった．

試験名	温度	湿度	保存形態	保存期間
長期保存試験	5±3℃	－	ガラスバイアル＋ゴム栓＋紙箱	24 箇月
加速試験	25±2℃	60±5%RH		6 箇月

製剤の有効期間は，ガラスバイアルに入れてゴム栓で封をし，これを紙箱で遮光して 2～8℃で保存するとき，24 箇月と設定された．なお，長期保存試験は継続予定である．

* 2.3 品質に関する概括資料を新薬承認情報提供時に本稿と置き換えた．