# ジャクスタピッドカプセル 5 mg

# ジャクスタピッドカプセル 10 mg

# ジャクスタピッドカプセル 20 mg

## CTD モジュール 2

## 品質に関する概括資料*

AEGERION PHARMACEUTICALS 株式会社

＊記載内容は、社団法人日本病院薬剤師会が推奨している医薬品
インタビューフォーム形式に準ずる内容に置き換えて公表する。

# 2.3.S 原薬

## 1. 一般名

### (1) 和名（命名法）

ロミタピドメシル酸塩(JAN)

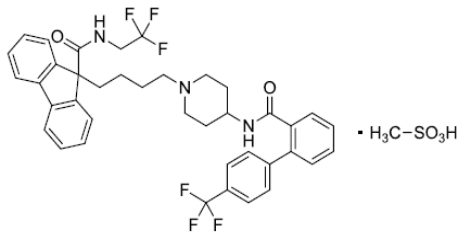
### (2) 洋名（命名法）

Lomitapide Mesilate (JAN)

### (3) ステム

ミクロソームトリグリセリド転送タンパク質阻害薬：-*tapide*

## 2. 構造式又は示性式




## 3. 分子式及び分子量

分子式： $C_{39}H_{37}F_6N_3O_2$ ・ $CH_4O_3S$

分子量： 789.83

## 4. 化学名（命名法）

*N*-(2,2,2-Trifluoroethyl)-9-[4-({4-[4'-(trifluoromethyl)biphenyl-2-yl]carboxamido}piperidin-1-yl)butyl]-9*H*-fluorene-9-carboxamide monomethanesulfonate

## 5. 慣用名、別名、略号、記号番号

開発番号： AEGR-733

## 6. CAS 登録番号

202914-84-9

## 7. 物理化学的性質

### (1) 外観・性状

白色～ほとんど白色の粉末である。

(2) 溶解性

pH2～5 の水溶液に溶けにくい。アセトン、エタノール及びメタノールに溶けやすく、2-ブタノール、ジクロロメタン及びアセトニトリルにやや溶けやすく、1-オクタノール及び 2-プロパノールにやや溶けにくく、酢酸エチルに溶けにくく、ヘプタンにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

本品は相対湿度 5%で質量が減量し、約-0.115%で平衡となった。吸着ステップでは、相対湿度 5～95%で徐々に吸湿し、最終的に+5.32%で平衡となった。脱着ステップでは、相対湿度 95～5%で約 5.32%の同じ質量減少が観察された。本品は比較的吸湿性である。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

152～153℃でわずかな吸熱が認められ、200～208℃で融解する。

(5) 酸塩基解離定数

pKa= 8.20±0.131

(6) 分配係数

pH 5.5 で 169 の最高値となり、pH が低くなると分配係数は減少し、pH 4.2 以下では 46～40 である。

(7) その他の主な示性値

飽和水溶液の pH=3.9（25±0.5℃）

## 8. 有効成分の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 | 試験結果 |
|---|---|---|---|---|---|
| 長期保存試験 | | 25℃/60%RH | 二重の LDPE 袋＋ポリエステル/アルミニウムホイルラミネート袋＋HDPE 製容器 | 12 箇月 | いずれの条件でも変化なし[1)] |
| 加速試験 | | 40℃/75%RH | | 6 箇月 | |
| 苛酷試験（光） | | 光（曝光及び遮光）[2)] | ペトリ皿 | 8 日 | いずれの条件でも変化なし[3)] |

1) 測定項目：性状（外観）、類縁物質、水分、結晶形及び含量
2) 光安定性試験ガイドラインに従う（総照度として120万lux･hr 以上；総近紫外放射エネルギーとして 200W・h／$m^2$ 以上）
3) 測定項目：性状（外観）、類縁物質、水分及び含量

## 9. 有効成分の確認試験法

赤外吸収スペクトル(KBr 法)

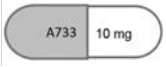
## 10. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

# 2.3.P 製剤

## 1. 剤　形

### (1) 剤形の区別、外観及び性状

| 販　売　名 | ジャクスタピッド<br>カプセル 5 mg | ジャクスタピッド<br>カプセル 10 mg | ジャクスタピッド<br>カプセル 20 mg |
|---|---|---|---|
| 外　　観 | 暗橙色（頭部）／暗橙色（胴部）の硬カプセル剤 | 暗橙色（頭部）／白色（胴部）の硬カプセル剤 | 白色（頭部）／白色（胴部）の硬カプセル剤 |
| 外　　形 |  |  |  |
| 大　き　さ | 長径 約 19.4 mm<br>短径 約 6.9 mm<br>重量 約 176 mg | 長径 約 19.4 mm<br>短径 約 6.9 mm<br>重量 約 276 mg | 長径 約 19.4 mm<br>短径 約 6.9 mm<br>重量 約 276 mg |

### (2) 製剤の物性

該当資料なし

### (3) 識別コード

| 販売名 | ジャクスタピッド<br>カプセル 5 mg | ジャクスタピッド<br>カプセル 10 mg | ジャクスタピッド<br>カプセル 20 mg |
|---|---|---|---|
| 識別<br>コード | A733／5 mg | A733／10 mg | A733／20 mg |

### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

## 2. 製剤の組成

### (1) 有効成分（活性成分）の含量

| 販売名 | ジャクスタピッド<br>カプセル 5 mg | ジャクスタピッド<br>カプセル 10 mg | ジャクスタピッド<br>カプセル 20 mg |
|---|---|---|---|
| 有効成分 | 1 カプセル中にロミタピドメシル酸塩 5.69mg（ロミタピドとして 5mg）を含有 | 1 カプセル中にロミタピドメシル酸塩 11.39mg（ロミタピドとして 10mg）を含有 | 1 カプセル中にロミタピドメシル酸塩 22.77mg（ロミタピドとして 20mg）を含有 |

### (2) 添加物

乳糖水和物、結晶セルロース、部分アルファー化デンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム

### (3) その他

該当しない

## 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## 4. 製剤の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 | 試験結果 |
|---|---|---|---|---|
| 長期保存試験 | 25℃/60%RH | 高密度ポリエチレン(HDPE)製瓶＋ポリプロピレン製キャップ | 24 箇月 | いずれの条件でも変化なし[2] |
| 加速試験 | 40℃/75%RH | | 6 箇月 | |
| 苛酷試験（光） | 光（曝光及び遮光）[1] | ペトリ皿（むき出しのカプセルで曝光及び遮光） | 7 日 | |
| 苛酷試験（凍結解凍サイクル） | -20℃と 40℃/75%RH の繰り返し（3 回） | 高密度ポリエチレン(HDPE)製瓶＋ポリプロピレン製キャップ | 6 日 | |
| 使用時の安定性試験[3] | 30℃/65%RH<br>30℃/75%RH | 高密度ポリエチレン(HDPE)製瓶＋ポリプロピレン製キャップ | 28 日間 | 水分量増加が認められたが、規格に適合[4] |

1）光安定性試験ガイドラインに従う（総照度として120万lux･hr 以上；総近紫外放射エネルギーとして200W・h／$m^2$ 以上）
2）測定項目：性状（外観）、類縁物質、水分、溶出性及び含量
3）1日1回製剤の瓶を開け、カプセルを取り出した後、瓶に戻し、瓶を閉じた。これを28日間繰り返し、安定性試験を実施した。
4）測定項目：性状（外観）、確認試験（HPLC）、類縁物質、水分、溶出性及び含量

## 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない

## 7. 溶出性

方法：パドル法（シンカーを用いる。）

条件：回転数50rpm

試験液：0.1% ポリソルベート80を添加した0.001mol/L 塩酸

## 8. 生物学的試験法

該当しない

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

質量分析法及び液体クロマトグラフィー

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

## 11. カ　価

該当しない

## 12. 混入する可能性のある夾雑物

加水分解物及び類縁物質の混在の可能性が考えられるが、安定性試験において、いずれも規格限度値以下であった。

## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

小児誤飲防止機能がついた瓶キャップである。

## 14. その他

該当しない