2.3 品質に関する概括資料（QOS）

緒言

シグニフォーLAR 筋注用キットは，有効成分としてパシレオチドパモ酸塩をパシレオチドとして 20 mg，40 mg，60 mg 含むマイクロスフェア型徐放性製剤であり，添付の専用分散液で用時懸濁して筋肉内投与する注射剤である。

申請医薬品の販売名，剤形等を以下に示す。

販売名	シグニフォーLAR 筋注用キット 20 mg，40 mg，60 mg
原薬の一般名	パシレオチドパモ酸塩
剤形	注射剤
含量	20 mg，40 mg 又は 60 mg
投与経路	筋肉内投与
適応症（効能又は効果）	先端巨大症・下垂体性巨人症

本キット製品は，マイクロスフェアを充填したバイアル，専用分散液を充填したガラス製シリンジ（プレフィルドシリンジ）及びバイアルアダプターから構成される。

2.3.S 原薬

1 名称

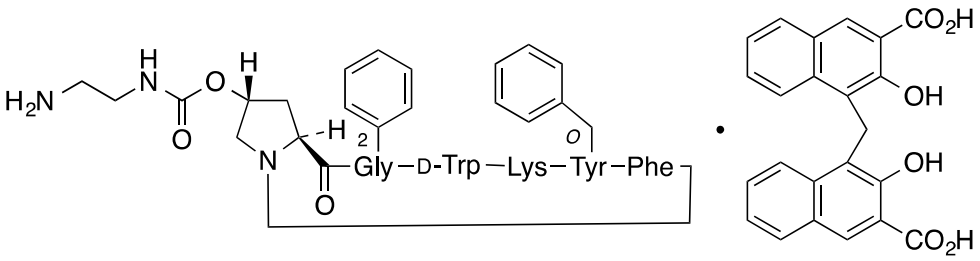
1) 一般名

パシレオチドパモ酸塩

2) 化学名

Cyclo[-(4*R*)-4-(2-aminoethylcarbamoyloxy)-L-prolyl-L-phenylglycyl-D-tryptophyl-L-lysyl-4-*O*-benzyl-L-tyrosyl-L-phenylalanyl-] mono[4,4'-methylenebis(3-hydroxy-2-naphthoate)]

3) 構造式



4) 分子式

$C_{58}H_{66}N_{10}O_9 \cdot C_{23}H_{16}O_6$（パモ酸塩）

$C_{58}H_{66}N_{10}O_9$（遊離塩基）

5) 分子量

1,435.58（パモ酸塩）

1,047.21（遊離塩基）

2 物理的化学的性質

1) 性状

パシレオチドパモ酸塩は，白色～うすい黄色の粉末である。

2) 溶解性

メタノールに溶けにくく，エタノール又はアセトンに極めて溶けにくく，水、2-プロパノール，1-オクタノール又はアセトニトリルにほとんど溶けない。

3 安定性

本薬を気密容器で包装し，-25～-15℃ で遮光して保存するとき，リテスト期間は 60 ヵ月である。

2.3.P 製剤

1 性状及び処方

1) バイアル製剤

本品はごくうすい黄色～うすい黄色の粉末である。

バイアル製剤の処方は以下のとおりである。

Table 1-1 バイアル製剤の処方

成分名	配合量		
	20 mg	40 mg	60 mg
パシレオチドパモ酸塩	1 バイアル中，パシレオチドパモ酸塩 32.904 mg（パシレオチドとして 24 mg）	1 バイアル中，パシレオチドパモ酸塩 65.808 mg（パシレオチドとして 48 mg）	1 バイアル中，パシレオチドパモ酸塩 98.712 mg（パシレオチドとして 72 mg）
乳酸・グリコール酸共重合体（11：9）グルコースエステル	31.548 mg	63.096 mg	94.644 mg
乳酸・グリコール酸共重合体（1：1）	31.548 mg	63.096 mg	94.644 mg
合計	96.00 mg*	192.00 mg*	288.00 mg*

*：調製時及び投与時の損失を考慮し，パシレオチドとしてそれぞれ 20 mg，40 mg，60 mg が投与できるよう 20%過量充填されている。

2) 分散液

本品は無色～微黄色又は微褐色澄明の液である。

本分散液は，1 シリンジ中（2.25 mL*），日局注射用水適量，及び添加剤として D-マンニトール 101.25 mg，カルメロースナトリウム 15.75 mg，ポリオキシエチレン（160）ポリオキシプロピレン（30）グリコール 4.5 mg を含有する。

*：2 mL が投与できるよう 0.25 mL 過量充填されている。

3 安定性

本キット製剤を 2～8℃ で凍結を避けて保存するとき，有効期間は 36 ヵ月である。