プララトレキサート

第 2 部（モジュール 2）: CTD の概要（サマリー）

2.3　品質に関する概括資料

（ジフォルタ注射液 20 mg、注射剤）

ムンディファーマ株式会社

目次

2.3.1 緒言 4

2.3.S 原薬（プララトレキサート） 5

2.3.P 製剤 7

表目次

表 1　有効成分の安定性試験.....6

表 2　製剤の安定性試験.....7

2.3.1　緒言

申請医薬品の販売名，一般的名称，申請者名，剤形，含量，投与経路及び効能又は効果を以下に示す.

販売名	ジフォルタ注射液 20 mg
一般的名称	プララトレキサート（JAN）
申請者名	ムンディファーマ株式会社
剤形	注射剤
含量	1 バイアル（1 mL）中にプララトレキサート 20 mg を含む
投与経路	静脈内投与
効能・効果	再発又は難治性の末梢性 T 細胞リンパ腫

2.3.S 原薬（プララトレキサート）*

1. 名称に関する項目

（1）一般的名称

日本名：プララトレキサート

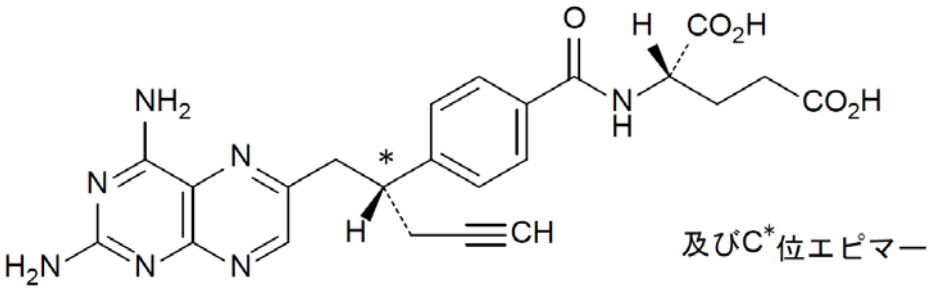
英名：Pralatrexate

（2）化学名

日本名：*N*-{4-[(2*RS*)-1-(2,4-ジアミノプテリジン-6-イル)ペンタ-4-イン-2-イル]ベンゾイル}-L-グルタミン酸

英名：*N*-{4-[(2*RS*)-1-(2,4-Diaminopteridin-6-yl)pent-4-yn-2-yl]benzoyl}-L-glutamic acid

（3）化学構造式



（4）分子式・分子量

$C_{23}H_{23}N_7O_5$　　477.47

（5）CAS 登録番号

146464-95-1

2. 有効成分に関する項目

（1）性状

微黄白色～黄色の固体である.

（2）融点

本品の融点は 216～220ºC である.

* 2.3.S を新薬承認情報提供時に本項と置き換えた.

（3）解離定数（pKa）

本品の解離定数（pKa）は 3.25，4.76 及び 6.18 である．

（4）分配係数（log P）

本品の分配係数（log P）は中性では 0.025 及びモノアニオン性では 0.011 である．

（5）溶解性

本品は pH6.5 以上の水溶液にやや溶けやすく，水，クロロホルム及びエタノール中に極めて溶けにくい．

（6）吸湿性

本品は吸湿性である．

（7）結晶多形

本品は単一の結晶形（Form A）を示す．

（8）粒子径

本品の粒子径（d_{90}）は，100 μm 未満である（レーザー回折法）．

3. 有効成分の安定性に関する項目

表 1　有効成分の安定性試験

試験名	基準ロット	温度	湿度	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	パイロットスケール：3ロット	5±3℃	－	ポリエチレン袋（二重）＋アルミニウム箔/ポリエチレン袋（乾燥剤入り）＋高密度ポリエチレン容器*	60箇月	変化なし
加速試験		25±2℃	60±5%RH		6箇月	変化なし

試験項目：性状，溶状（長期保存試験のみ），純度試験（類縁物質），水分，エンドトキシン，微生物限度及び含量

光安定性試験の結果，光の影響を受けやすいことが明らかとなった

*：輸送及び保管時の衝撃から保護する目的で高密度ポリエチレン容器に梱包した

2.3.P 製剤 *

1. 組成

本剤は静脈内投与用の注射剤であり，1 バイアル（1 mL）あたりプララトレキサート 20 mg を含有する.

2. 添加剤

塩化ナトリウム，水酸化ナトリウム，塩酸及び注射用水

3. 性状

黄色澄明の液

4. 製剤の安定性

以下の安定性試験結果に基づき，製剤の有効期間は，ガラスバイアルに入れゴム栓（クロロブチルゴム）で封をし，これを紙箱で遮光して 2～8℃で保存するとき，48 箇月と設定する

表 2　製剤の安定性試験

試験名	基準ロット	温度	湿度	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	実生産スケール：3ロット	5±3℃	―	ガラスバイアル＋ゴム栓＋紙箱	2ロット：60箇月 1ロット：48箇月	変化なし
加速試験		25±2℃	60±5%RH		6箇月	変化なし

試験項目：性状，浸透圧，pH，純度試験（類縁物質），エンドトキシン，無菌，不溶性微粒子，不溶性異物，容器完全性及び含量
安定性試験は継続中
光安定性試験の結果，製剤は光の影響を受けるが，遮光条件下では安定であった

* 2.3.P を新薬承認情報提供時に本項と置き換えた.