# レキサルティ錠 1 mg
# レキサルティ錠 2 mg

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

大塚製薬株式会社

## 2.3 品質に関する概括資料

### 緒言

申請医薬品の販売名，剤型等は下記のとおりである。

| | |
|---|---|
| 販売名 | レキサルティ錠 1 mg 及び 2 mg |
| 原薬の一般名 | ブレクスピプラゾール |
| 剤形 | 錠剤（フィルムコーティング錠） |
| 企業名 | 大塚製薬株式会社 |
| 含量（力価） | 1 mg 及び 2 mg |
| 投与経路 | 経口投与 |
| 適応症（効能又は効果） | 統合失調症 |

## 2.3.S 原薬

### 1. 一般名

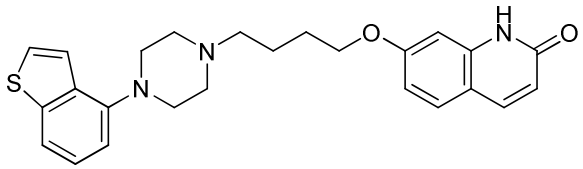
#### （1）和名

ブレクスピプラゾール（JAN）

#### （2）洋名

Brexpiprazole（JAN，INN）

### 2. 構造式又は示性式



### 3. 分子式及び分子量

分子式：$C_{25}H_{27}N_3O_2S$

分子量：433.57

### 4. 化学名

7-{4-[4-(1-Benzothiophen-4-yl)piperazin-1-yl]butyloxy}quinolin-2(1*H*)-one

7-{4-[4-(1-ベンゾチオフェン-4-イル)ピペラジン-1-イル]ブチルオキシ}キノリン-2(1*H*)-オン

### 5. 物理的化学的性質

#### （1）外観・性状

白色（ほとんど白色を含む）の結晶又は結晶性の粉末である。

#### （2）溶解性

*N*-メチルピロリドンに溶けやすく，*N,N*-ジメチルアセトアミドにやや溶けやすく，メタノールに溶けにくく，エタノール（99.5）に極めて溶けにくく，水にほとんど溶けない。

### 6. 安定性

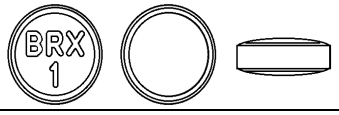
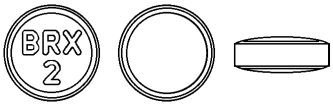
| 試験の種類 | | 保存条件 | 保存形態 | 保存期間 | 結果 |
|---|---|---|---|---|---|
| 長期保存試験 | | 30°C/65% RH | 二重ポリエチレン袋／ファイバードラム | 60箇月 | 変化なし |
| 加速試験 | | 40°C/75% RH | | 6 箇月 | |
| 苛酷試験 | 温度 | 50°C | 褐色ガラス瓶（気密） | 3箇月 | 変化なし |
| | 湿度 | 25°C/90% RH | ガラス容器（開放） | | |
| | 温湿度 | 40°C/75% RH | | | |
| | 光 | 白色・近紫外蛍光ランプ（3,000 lx・50 μW/cm$^2$） | ガラスシャーレ（ポリ塩化ビニリデン製フィルムで覆った） | 600時間 | 規格内での着色傾向が認められた以外に変化なし |

---

注：「2.3.S 原薬」の項（page 2～194）をまとめて示した。

## 2.3.P 製剤

### 1. 剤形

| 販売名 | 性 状 | 外 形 | 直径 (mm) | 厚さ (mm) | 重さ (mg) | 識別コード |
|---|---|---|---|---|---|---|
| レキサルティ錠 1 mg | 淡黄色のフィルムコーティング錠 |  | 6.1 | 2.7 | 約 93 | BRX 1 |
| レキサルティ錠 2 mg | 淡緑色のフィルムコーティング錠 |  | 6.1 | 2.7 | 約 93 | BRX 2 |

### 2. 製剤の組成

| 販売名 | 有効成分の含量 | 添加物 |
|---|---|---|
| レキサルティ錠 1 mg | 1 錠中にブレクスピプラゾール 1 mg を含有 | 乳糖水和物，トウモロコシデンプン，結晶セルロース，ヒドロキシプロピルセルロース，ステアリン酸マグネシウム，ヒプロメロース，タルク，酸化チタン，黄色三二酸化鉄 |
| レキサルティ錠 2 mg | 1 錠中にブレクスピプラゾール 2 mg を含有 | 乳糖水和物，トウモロコシデンプン，結晶セルロース，ヒドロキシプロピルセルロース，ステアリン酸マグネシウム，ヒプロメロース，タルク，酸化チタン，黄色三二酸化鉄，黒酸化鉄 |

### 3. 安定性

| 試験の種類 | | 保存条件 | 保存形態 | 保存期間 | 結果 |
|---|---|---|---|---|---|
| 長期保存試験 | | 25°C/60% RH | ①PTP<br>②ポリエチレン瓶 [a)] | 36 箇月 | ①分解物増加（規格内），水分増加，崩壊時間短縮<br>②分解物増加（規格内） |
| 加速試験 | | 40°C/75% RH | | 6 箇月 | ①分解物増加（規格内），水分増加，崩壊時間短縮<br>②分解物増加（規格内） |
| 苛酷試験 | 温度 | 50°C | | 3 箇月 | ①分解物増加（規格内），水分減少<br>②分解物増加（規格内） |
| | 湿度 | 40°C/75% RH | 無包装 | 3 箇月 | 水分増加，崩壊時間短縮 |
| | 光 | 白色・近紫外蛍光ランプ（3,000 lx・50 μW/cm$^2$） | | 180 万 lx･h / 300 W･h/m$^2$ | 変化なし |
| 使用時試験 | | 25°C/80% RH | | 3 箇月 | 水分増加，硬度低下 [b)]，崩壊時間短縮 |

a) ポリエチレン瓶は 0.25 mg 錠及び 4 mg 錠を用いたブラケッティング法により実施した。なお、本邦では 0.25 mg 錠及び 4 mg 錠の製造販売承認は取得していない。

b) 1 箇月後から 30%以上の硬度低下を示したため、「硬度の低下」と記載した。低下したが、保存期間中は 2.0 kg 重以上を維持した。

---

注：「2.3.P 製剤」の項（page 2～168）をまとめて示した。