ラパリムスゲル0.2%

製造販売承認申請書添付資料

第2部（モジュール2）

2.3　品質に関する概括資料

本項は、医薬品インタビューフォームに準ずる内容に置き換えた。

ノーベルファーマ株式会社

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ラパリムス®ゲル 0.2%

(2) 洋名

Rapalimus® Gel 0.2%

(3) 名称の由来

一般名の「シロリムス（別名：ラパマイシン)」の「ラパ」と「リムス」に由来する。なお、本化合物はイースター島（ポリネシア語名：ラパ・ヌイ）の土壌から分離された細菌の代謝産物であり、抗生物質として見出されたことから「ラパマイシン」と名付けられている。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

シロリムス（JAN)

(2) 洋名（命名法）

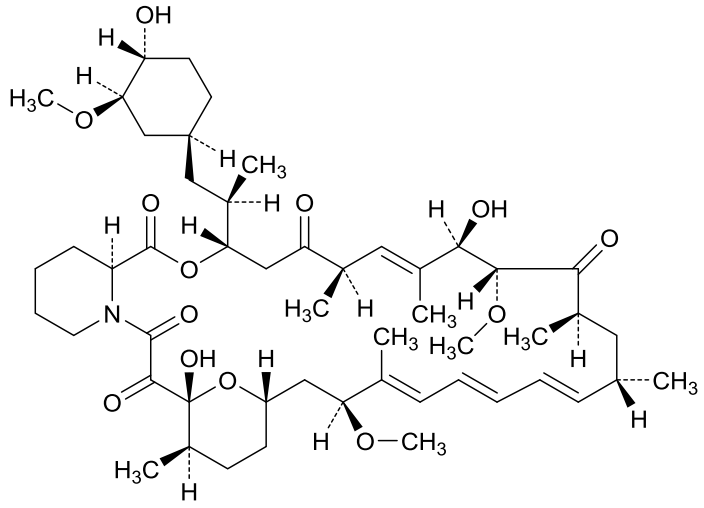
Sirolimus (JAN)、sirolimus (r-INN)

(3) ステム

immunosuppressants, rapamycin derivatives：-rolimus

3. 構造式又は示性式

構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{51}H_{79}NO_{13}$

分子量：914.17

5. 化学名（命名法）

(1*R*,9*S*,12*S*,15*R*,16*E*,18*R*,19*R*,21*R*,23*S*,24*E*,26*E*,28*E*,30*S*,32*S*,35*R*)-1,18-ジヒドロキシ-12-{(1*R*)-2-[(1*S*,3*R*,4*R*)-4-ヒドロキシ-3-メトキシシクロヘキシル]-1-メチルエチル}-19,30-ジメトキシ-15,17,21,23,29,35-ヘキサメチル-11,36-ジオキサ-4-アザトリシクロ[30.3.1.$0^{4,9}$]ヘキサトリアコンタ-16,24,26,28-テトラエン-2,3,10,14,20-ペンタオン

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～灰白色の粉末である。

(2) 溶解性

本品は、アセトン、メタノール及びジメチルスルホキシドに溶けやすく、水にはほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：180～185℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

4.56（*n*-オクタノール／水）

(7) その他の主な示性値

$[\alpha]_{D}^{20}$：-146 ～ -160°（脱水物に換算したもの 0.5 g、メタノール、50 mL、100 mm）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

本品は、気密容器において、加速条件（25℃／60%RH）で 6 ヵ月、長期保存条件（5℃）で 36 ヵ月安定であった。

Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1)剤形の区別、外観及び性状

ラパリムスゲル 0.2%：1 g 中にシロリムス 2 mg を含有する無色透明のゲル剤

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

ゲル 1 g 中にシロリムス 2 mg を含有する。

(2) 添加物

カルボキシビニルポリマー、エタノール、トリエタノールアミン

3. 製剤の各種条件下における安定性

試験		温度	湿度	照度	包装形態	保存期間	結果
長期保存試験		5℃	―	―	アルミチューブ	12 箇月	12 箇月で規格内（ただし、含量低下が認められた）
加速試験		25℃	60%RH	―	アルミチューブ	3 箇月	明確な品質の変化あり
苛酷試験	熱	40℃	―	―	アルミチューブ	2 週間	明確な品質の変化あり
	光	25℃	―	2000 lx (D65 ﾗﾝﾌﾟ)	透明ガラス瓶密栓(曝光)	総照度 60 万 lx･h (116 W･h/m^2)	明確な品質の変化あり
					透明ガラス瓶密栓(遮光)	総照度 90 万 lx･h (181 W･h/m^2)	安定