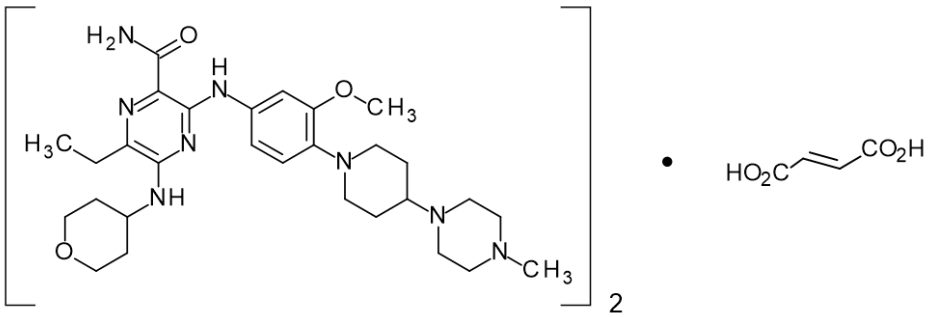
2.3 品質に関する概括資料*

申請医薬品の販売名，剤形等は以下の通りである。

販売名	ゾスパタ錠 40 mg
原薬の一般名	ギルテリチニブフマル酸塩
企業名	アステラス製薬株式会社
剤形	フィルムコーティング錠
成分・含量（1 錠中）	ギルテリチニブフマル酸塩 44.2 mg （ギルテリチニブとして 40 mg）

2.3.S 原薬*

1. 名称に関する項目

一般名	（日本名）ギルテリチニブフマル酸塩
	（英　名）Gilteritinib Fumarate（JAN）
化学名	6-Ethyl-3-{3-methoxy-4-[4-(4-methylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]anilino}-5-[(oxan-4-yl)amino]pyrazine-2-carboxamide hemifumarate
分子量	1221.50
分子式	$(C_{29}H_{44}N_8O_3)_2 \cdot C_4H_4O_4$
構造式	
CAS 登録番号	1254053-84-3

2. 物理化学的性質

項目	結果	
性状	淡黄色～黄色の結晶又は粉末	
融点	約 238°C で分解する	
酸塩基解離定数	pKa＝2.3, 5.0, 7.9	
分配係数 （オクタノール／水）	logP=3.9	
溶解性（20±5℃）	水 エタノール（99.5）	やや溶けにくい 極めて溶けにくい
	水溶液（pH 1） 水溶液（pH 3） 水溶液（pH 5） 水溶液（pH 7） 水溶液（pH 9） 水溶液（pH 11）	溶けやすい 溶けやすい やや溶けやすい ほとんど溶けない ほとんど溶けない ほとんど溶けない
吸湿性	なし	

3. 安定性

試験の種類	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25℃/60％RH	24 箇月	二重のポリエチレン袋＋ポリエチレンチューブ，スチールドラム	変化なし
加速試験	40℃/75％RH	6 箇月		変化なし
苛酷試験	40℃/75％RH	3 箇月	褐色ガラス瓶（開放）	変化なし
	60℃	3 箇月	褐色ガラス瓶（開放）	変化なし
	D65，蛍光ランプ（1000 lux）	2 箇月	シャーレ	類縁物質のわずかな増加を認めたが、規格の範囲内であった。

4. 確認試験法

（1）　紫外可視吸光度測定法

（2）　赤外吸収スペクトル測定法

（3）　薄層クロマトグラフィー

5. 定量法

（1）　液体クロマトグラフィー

2.3.P 製剤*

1. 組成

販売名	ゾスパタ錠 40 mg
有効成分の含量（1 錠中）	ギルテリチニブフマル酸塩　44.2 mg （ギルテリチニブとして 40 mg）
添加剤	D-マンニトール，ヒドロキシプロピルセルロース，低置換度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，マクロゴール，酸化チタン，タルク，黄色三二酸化鉄

2. 安定性

試験	保存条件		保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C/60％RH		PTP(PVC/AL)	24 箇月	変化なし
加速試験	40°C/75％RH		PTP(PVC/AL)	6 箇月	変化なし
苛酷試験	温度	50°C	ボトル（開放）	3 箇月	変化なし
	湿度	40°C/75％RH	ボトル（開放）	6 箇月	変化なし
	光	D65 ランプ（3000lux）	シャーレ（開放）	17 日間	類縁物質の増加を認めた。
			PTP(PVC/AL)		変化なし
		キセノンランプ（30000lux）	シャーレ（開放）	40 時間	変化なし

3. 製剤中の有効成分の確認試験法

（1）　紫外可視吸光度測定法

4. 製剤中の有効成分の定量法

（1）　液体クロマトグラフィー

*　2.3 品質に関する概括資料を新薬承認情報提供時に本項と置き換えた。