第 2 部　CTD の概要

一般名：ブデソニド
　　グリコピロニウム臭化物
　　ホルモテロールフマル酸塩水和物

2.3　品質に関する概括資料[注)]
PT010

本資料に記載された情報に係る権利はアストラゼネカ株式会社に帰属します。弊社の事前の承諾なく本資料の内容を他に開示することは禁じられています。

注）「2.3 品質に関する概括資料」を新薬承認情報提供時に置き換え

2.3.S　原薬

ブデソニド

一般的名称（JAN）

ブデソニド（Budesonide）

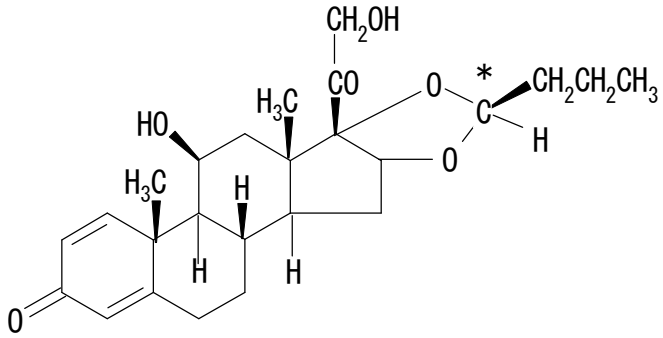
化学名

(+)-[(*RS*)-16α,17α-butylidenedioxy-11β,21-dihydroxy-1,4-pregnadiene-3,20-dione]

CAS 登録番号

51333-22-3

構造式



*ブデソニドは 22 位の不斉炭素原子におけるエピマーの混合物である。

分子式

$C_{25}H_{34}O_6$

分子量

430.53

グリコピロニウム臭化物

一般的名称（JAN）

グリコピロニウム臭化物（Glycopyrronium Bromide）

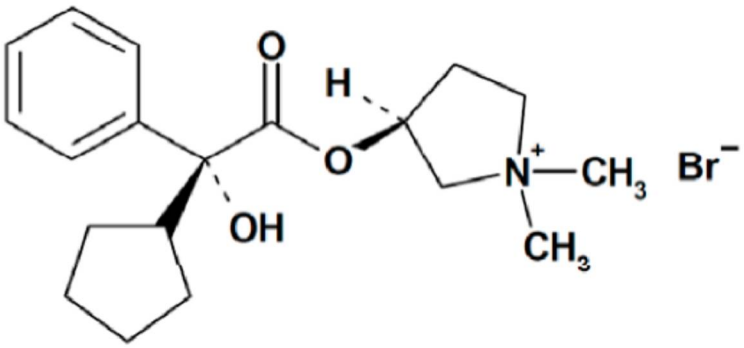
化学名

(3*RS*)-3-[(2*SR*)-(2-Cyclopentyl-2-hydroxy-2-phenylacetyl)oxy]-1,1-dimethylpyrrolidinium bromide

CAS 登録番号

596-51-0

構造式



及び鏡像異性体

分子式

$C_{19}H_{28}BrNO_3$

分子量

398.33

ホルモテロールフマル酸塩水和物

一般的名称（JAN）

ホルモテロールフマル酸塩水和物（Formoterol Fumarate Hydrate）

化学名

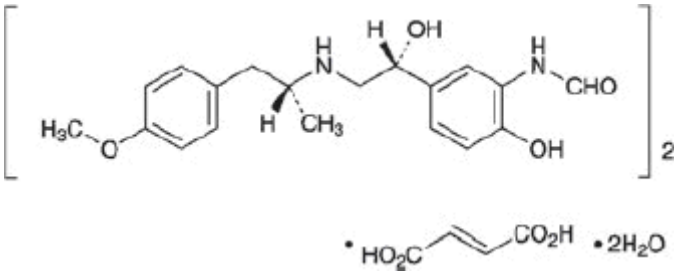
N-(2-Hydroxy-5-{(1*RS*)-1-hydroxy-2-[(1*RS*)-2-(4-methoxyphenyl)-1-methylethylamino]ethyl}phenyl) formamide hemifumarate monohydrate

CAS 登録番号

43229-80-7（ホルモテロールフマル酸塩）

73573-87-2（ホルモテロール）

構造式



及び鏡像異性体

分子式

$(C_{19}H_{24}N_2O_4)_2 \cdot C_4H_4O_4 \cdot 2H_2O$

分子量

840.91

2.3.P 製剤

組成及び性状：

販売名	ビレーズトリ™エアロスフィア®56 吸入　　ビレーズトリ™エアロスフィア®120 吸入
有効成分	1 回噴霧量（送達量）： ブデソニド 160μg グリコピロニウム臭化物 9.0μg （グリコピロニウムとして 7.2μg） ホルモテロールフマル酸塩水和物 5.0μg （ホルモテロールフマル酸塩として 4.8μg）
添加剤	多孔性粒子（1,2-ジステアロイル-*sn*-グリセロ-3-ホスホコリン及び塩化カルシウム水和物から成る）、1,1,1,2-テトラフルオロエタン
剤形・性状	用時作動により一定量の薬液が噴霧される吸入エアゾール剤である

安定性：
120 吸入製剤、開発段階で製造した 28 吸入製剤（56 吸入製剤及び 120 吸入製剤と製剤処方及び容器施栓系が同一で、充填量が異なる製剤）を用いたブラケッティング法を適用し、56 吸入製剤の安定性試験を省略した。

試験名	製剤	保存条件		保存形態	保存期間	結果
		温度	湿度			
長期保存試験	28 吸入			アルミ袋包装		規格内
	120 吸入	25°C	60%RH	（乾燥剤入り）	24 カ月	規格内
				バルブ上向き・下向き		
中間的試験	28 吸入			アルミ袋包装		規格内
	120 吸入	30°C	75%RH	（乾燥剤入り）	12 カ月	規格内
				バルブ上向き・下向き		
加速試験	28 吸入			アルミ袋包装		6 カ月時点でホルモテロールフマル酸塩由来の分解生成物が増加した。
				（乾燥剤入り）		
				バルブ上向き・下向き		
		40°C	75%RH		6 カ月	
	120 吸入					3 カ月時点で送達量均一性が規格外となった。

試験項目：性状、1 缶当たりの含量、分解生成物、水分、送達量均一性、空気力学的粒度
ただし、中間的試験は、1 缶当たりの含量、分解生成物、送達量均一性