2.3 品質に関する概括資料

2.3.S 原薬[1]（キザルチニブ塩酸塩）

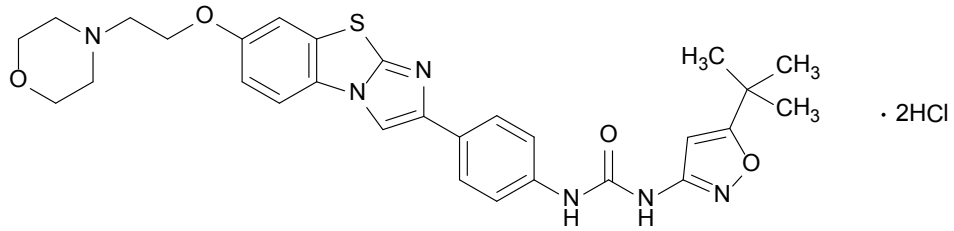
一 般 名 ： キザルチニブ塩酸塩

化 学 名 ： 1-(5-*tert*-Butyl-1,2-oxazol-3-yl)-3-(4-{7-[2-(morpholin-4-yl)ethoxy] imidazo[2,1-*b*][1,3]benzothiazol-2-yl}phenyl)urea dihydrochloride

分 子 式 ： $C_{29}H_{32}N_6O_4S \cdot 2HCl$

分 子 量 ： 633.59

構 造 式 ：



性　状 ： 白色～薄い灰色又は黄みの薄い灰色の固体

融　点 ： 約 228°C（分解）

分配係数： p*K*a と Log P から算出された分配係数（Log D）は 2.32（水層の pH 7.4）であった。

安定性

原薬の主な安定性試験は以下の表に示すとおりである。また、光安定性試験の結果、原薬は光に安定であった。

試験	保存条件	包装形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	ポリエチレンスリーブ/ポリエチレン袋/アルミラミネート袋	48 ヵ月	安定
加速試験	40°C/75%RH		6 ヵ月	安定

[1]「2.3.S 原薬」の項をまとめて記載した。

2.3.P 製剤[2]（ヴァンフリタ錠 17.7 mg、26.5 mg、錠剤）

組成（1 錠中）・性状

販売名	有効成分	添加剤	性状
ヴァンフリタ錠 17.7 mg	キザルチニブ塩酸塩 20mg（キザルチニブとして 17.7mg）	ヒドロキシプロピル-β-シクロデキストリン、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、タルク、トリアセチン、酸化チタン	白色のフィルムコーティング錠
ヴァンフリタ錠 26.5 mg	キザルチニブ塩酸塩 30mg（キザルチニブとして 26.5mg）	ヒドロキシプロピル-β-シクロデキストリン、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、タルク、トリアセチン、酸化チタン、黄色三二酸化鉄	黄色のフィルムコーティング錠

安定性

製剤の主な安定性試験は以下の表に示すとおりである。また、光安定性試験の結果、製剤は光に安定であった。

試験	保存条件	包装形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	PTP（ポリクロロトリフルオロエチレン/ポリ塩化ビニル及びアルミニウム）包装	36 ヵ月	安定
加速試験	40°C/75%RH		6 ヵ月	安定

[2]「2.3.P 製剤」の項をまとめて記載した。

2.3.A その他（ヴァンフリタ錠 17.7 mg、26.5 mg、錠剤）

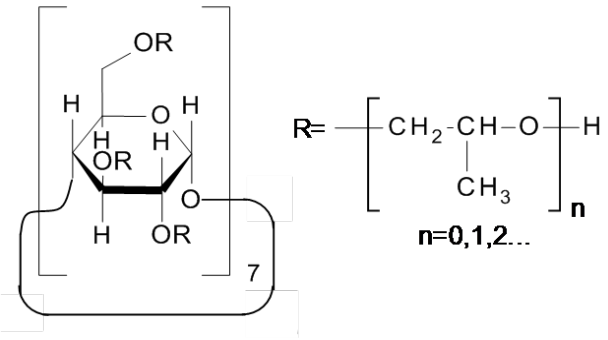
2.3.A.3 添加剤[3]（ヒドロキシプロピル-β-シクロデキストリン）

化 学 名 ： 2-Hydroxypropan-1-yl-β-cyclodextrin

一 般 名 ： ヒドロキシプロピル–β–シクロデキストリン（INN 及び JAN は該当しない）

分 子 式 ： $C_{(6\times7+3\times3n)}H_{(7\times7+3\times6n+3)}O_{(5\times7+3n)}$

構 造 式 ：



C A S 登録番号： 128446-35-5 (Hydroxypropyl-beta-cyclodextrin)

一般特性： ヒドロキシプロピル–β–シクロデキストリンは、β–シクロデキストリンにヒドロキシプロピル基が導入された構造を有する。

性 状 ： 白色～薄い灰色又は黄みの薄い灰色の粉末

融 点 ： 120ºC～160ºC

分配係数： 1-オクタノールと水の分配係数（log P_{ow}）：< 0.000

安定性

試験	保存条件	包装形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	低密度ポリエチレン袋/ 高密度ポリエチレンプラスチックドラム	35 ヵ月	安定

[3]「2.3.A その他」の項をまとめて記載した。