レミマゾラムベシル酸塩
アネレム静注用 50 mg

第 2 部 CTD の概要
2.3 品質に関する概括資料

ムンディファーマ株式会社

2.3.S　原薬（レミマゾラムベシル酸塩）

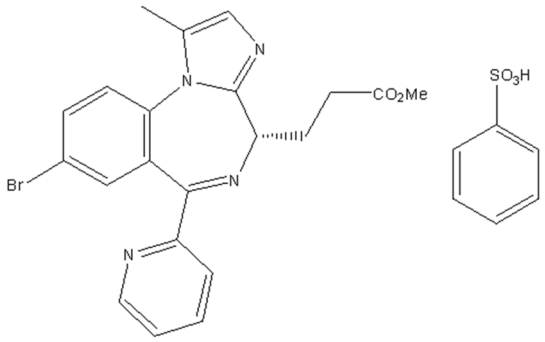
一般的名称：　レミマゾラムベシル酸塩
Remimazolam Besilate

化学名：

（英名）　Methyl 3-{(4*S*)-8-bromo-1-methyl-6-pyridin-2-yl-4*H*-imidazo[1,2-*a*][1,4]benzodiazepin-4-yl} propanoate monobenzenesulfonate

（日本名）　3-[(4*S*)-8-ブロモ-1-メチル-6-ピリジン-2-イル-4*H*-イミダゾ[1,2-*a*][1,4]ベンゾジアゼピン-4-イル]プロピオン酸メチル 一ベンゼンスルホン酸塩

構造式：



分子式：　$C_{21}H_{19}BrN_4O_2 \cdot C_6H_6O_3S$

分子量：　597.48（$C_{21}H_{19}BrN_4O_2 \cdot C_6H_6O_3S$ として）
439.31（$C_{21}H_{19}BrN_4O_2$ として）

性状：　白色～微黄色の結晶性の粉末

融点：　195～205°C

分配係数：　Log $D_{7.4}$＝2.55

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	5°C	低密度ポリ袋/HDPE 容器（シリカゲル入り）	36 ヵ月	全試験項目でほとんど変化なし。
加速試験	25°C/60%RH		36 ヵ月	全試験項目でほとんど変化なし。
苛酷試験（光）	120 万 lux•hr 以上、近紫外エネルギー200 watt•hr 以上	ペトリ皿	48 時間	外観が「褐色の結晶性の粉末」に変化したが、その他の試験項目で変化なし。

「2.3.S 原薬」の項をまとめて記載した。

2.3.P　製剤（アネレム静注用 50 mg、凍結乾燥注射剤）

組成（1 バイアル中）・性状

販売名		アネレム静注用 50 mg
成分・分量 （1 バイアル中）		レミマゾラムベシル酸塩 68.01 mg （レミマゾラムとして 50.00 mg）
添加剤 （1 バイアル中）	乳糖水和物	131.89 mg
	デキストラン 40	197.84 mg
	pH 調整剤	適量
性状		白色～微黄白色の粉末
pH 注)		2.9～3.9
浸透圧比注)（生理食塩液に対する比）		約 1.2

注）本剤 1 バイアルに生理食塩液 10 mL を加えて溶解した場合。

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	ガラスバイアル/黒色ポリプロピレン容器	36 ヵ月	加水分解物のわずかな増加が認められたが、規格の範囲内。その他の試験項目に変化なし。
加速試験	40°C/75% RH	ガラスバイアル/黒色ポリプロピレン容器	6 ヵ月	加水分解物のわずかな増加が認められたが、規格の範囲内。その他の試験項目に変化なし。
苛酷試験（光）	120 万 lux•hr 以上、近紫外エネルギー200 watt•hr 以上	ガラスバイアル	24 時間	外観が「灰色の粉末」に変化し、規格上限を超えた分解物及び構造未知の分解物が認められた。その他の試験項目はほとんど変化なし。 なお、遮光保存したバイアルでは変化なし。

「2.3.P 製剤」の項をまとめて記載した。