アイラミド配合懸濁性点眼液

CTD 第 2 部 CTD の概要（サマリー）

2.3 品質に関する概括資料

千寿製薬株式会社

2.3 品質に関する概括資料

2.3 緒言

申請医薬品の販売名、剤形等は下記のとおりである。

販売名	アイラミド配合懸濁性点眼液	
原薬の一般名	ブリモニジン酒石酸塩	ブリンゾラミド
企業名	千寿製薬株式会社	
剤形	無菌水性懸濁点眼剤	
成分・分量（1 mL 中）	1 mg	10 mg
効能・効果	次の疾患で、他の緑内障治療薬が効果不十分な場合： 緑内障、高眼圧症	

2.3.S 原薬（ブリモニジン酒石酸塩）

1. 名称・構造

1) 化学名

（日本名）

5-ブロモ-*N*-(4,5-ジヒドロ-1*H*-イミダゾール-2-イル)キノキサリン-6-アミン 一-(2*R*,3*R*)-酒石酸塩

（英名）

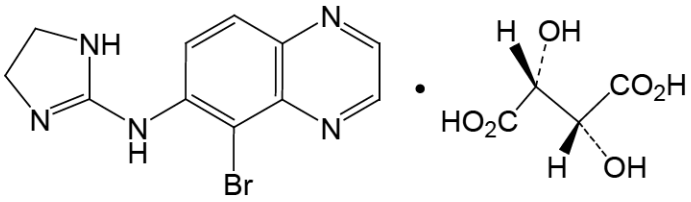
5-Bromo-*N*-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)quinoxalin-6-amine mono-(2*R*,3*R*)-tartrate

2) JAN

（日本名）ブリモニジン酒石酸塩

（英名）Brimonidine Tartrate

3) 化学構造



4) 分子式

$C_{11}H_{10}BrN_5 \cdot C_4H_6O_6$

5) 分子量

442.22

2. 一般特性

1) 性状

ブリモニジン酒石酸塩は白色～微黄色の粉末である。

2) 溶解性

水にやや溶けやすく、ジメチルホルムアミド又はメタノールに溶けにくく、アセトン、塩化メチレン又は酢酸エチルにほとんど溶けない。

3. 安定性

ブリモニジン酒石酸塩で実施された主な安定性試験の結果は表 1 のとおりであった。

表 1　ブリモニジン酒石酸塩の安定性試験

試験	温度	湿度	包装形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C	60% RH	透明ポリエチレン袋／黒色ポリエチレン袋／高密度ポリエチレンの容器	48 ヵ月	安定であった
加速試験	40°C	75% RH		6 ヵ月	安定であった

※2.3 品質に関する概括資料における 2.3 緒言及び 2.3.S 原薬（ブリモニジン酒石酸塩）の記載を前ページ及び当ページに集約した。

2.3.S 原薬（ブリンゾラミド）

1. 名称・構造

1) 化学名

（日本名）

(*R*)-4-(エチルアミノ) -3,4-ジヒドロ-2-(3-メトキシプロピル)- 2*H*-チエノ[3,2-*e*]-1,2-チアジン-6-スルホンアミド 1,1-ジオキシド

（英名）

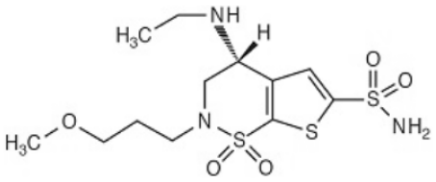
(*R*)-4-(Ethylamino)-3,4-dihydro-2-(3-methoxypropyl)-2*H*-thieno[3,2-*e*]-1,2-thiazine-6-sulfonamide 1,1-dioxide

2) JAN

（日本名）ブリンゾラミド

（英名）Brinzolamide

3) 化学構造



4) 分子式

$C_{12}H_{21}N_3O_5S_3$

5) 分子量

383.51

2. 一般特性

1) 性状（外観）

ブリンゾラミドは白色の結晶性の粉末である。

2) 溶解性

メタノールにやや溶けにくく、エタノール（99.5）又はイソプロパノールに溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

3. 安定性

ブリンゾラミドで実施された主な安定性試験の結果は表 2 のとおりであった。

表 2　ブリンゾラミドの安定性試験

試験	温度	湿度	包装形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C	60% RH	ポリエチレン袋／アルミニウム袋／ファイバードラム	36 ヵ月	安定であった
加速試験	40°C	75% RH		6 ヵ月	安定であった

※2.3 品質に関する概括資料における 2.3 緒言及び 2.3.S 原薬（ブリンゾラミド）の記載を当ページに集約した。

2.3.P 製剤

1. 組成

有効成分	1mL 中ブリモニジン酒石酸塩 1mg 及びブリンゾラミド 10mg
添加剤	チロキサポール、濃グリセリン、ホウ酸、カルボキシビニルポリマー、エデト酸ナトリウム水和物、ベンザルコニウム塩化物、等張化剤、pH 調節剤

2. 性状

性状	振り混ぜるとき、白色～微黄白色の無菌水性懸濁点眼剤
pH	6.3～6.8
浸透圧比	生理食塩液に対する比：0.9～1.2

3. 安定性

製剤で実施された主な安定性試験の結果は表 3 のとおりであった。また、光安定性試験の結果、製剤は光に安定であった。さらに、繰り返し使用時の安定性試験の結果、品質の明確な変化は認められず安定であった。

表 3　製剤の安定性試験

試験	温度／湿度	包装形態	保管期間	結果
長期保存試験	25℃／40%RH	5 mL 緑色ポリエチレン製容器に入れ、シュリンクラベル包装し、紙箱包装	12 ヵ月（継続試験中）	安定であった。
加速試験	40℃／25%RH 以下		6 ヵ月	類縁物質及び光学異性体の増加を認めた。
苛酷試験（温度）	60℃／成り行き		4 週間	類縁物質及び光学異性体の増加を認めた。

2.3.A その他

チロキサポールが新規添加剤に該当する。

※2.3 品質に関する概括資料における 2.3.P 製剤及び 2.3.A その他の記載を当ページに集約した。