2.3 品質に関する概括資料の目次

2.3.S 原薬..... 2
2.3.P 製剤..... 4

2.3.S 原薬*

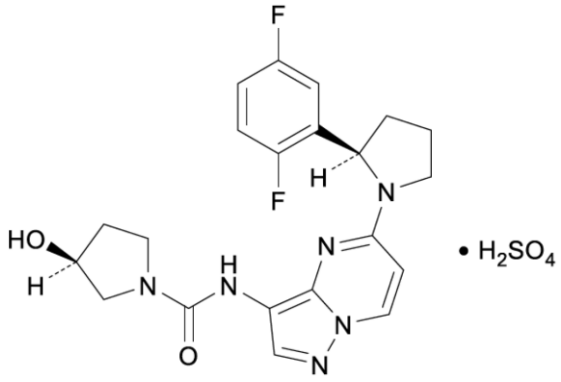
INN： larotrectinib

JAN: ラロトレクチニブ硫酸塩

化学名： (3*S*)-*N*-{5-[(2*R*)-2-(2,5-Difluorophenyl)pyrrolidin-1-yl]pyrazolo[1,5-α]pyrimidin-3-yl}-3-hydroxypyrrolidine-1-carboxamide monosulfate

CAS 登録番号： 1223405-08-0 (sulfate)、1223403-58-4 (free base)

構造式:



分子式：$C_{21}H_{22}F_2N_6O_2 \cdot H_2SO_4$

分子量：526.51

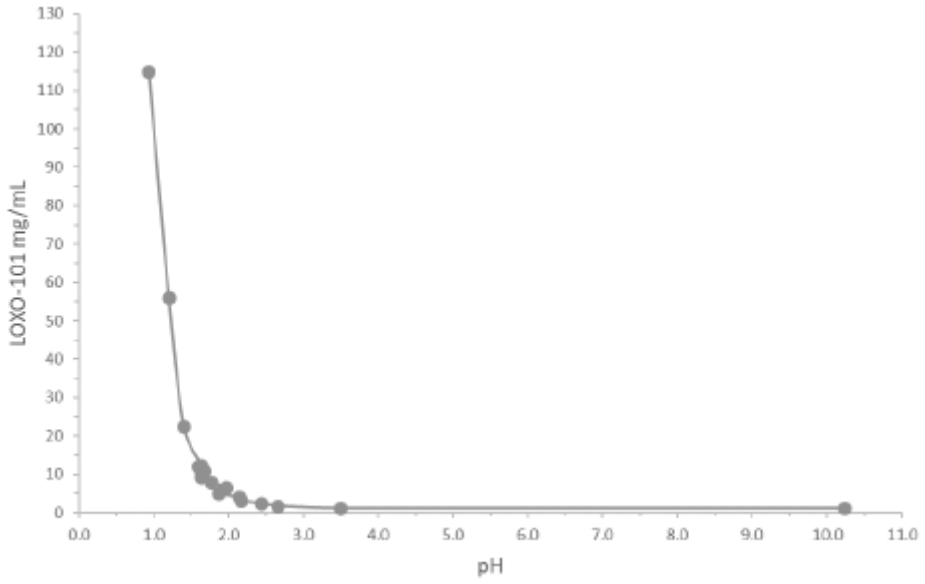
性状：白色～黄色又は淡紅みの黄色の粉末

溶解性（室温）：

溶媒	溶解度（mg/mL）	日本薬局方の溶解度表記
テトラヒドロフラン	0.00022	ほとんど溶けない
トルエン	0.00024	ほとんど溶けない
ヘプタン	0.00041	ほとんど溶けない
酢酸イソプロピル	0.00044	ほとんど溶けない
酢酸エチル	0.00046	ほとんど溶けない
tert-ブチルメチルエーテル	0.00048	ほとんど溶けない
2-メチルテトラヒドロフラン	0.0061	ほとんど溶けない
メチルエチルケトン	0.0166	ほとんど溶けない
アセトン	0.038	ほとんど溶けない
2-プロパノール	0.334	極めて溶けにくい
アセトニトリル	0.36	極めて溶けにくい
エタノール	2.6	溶けにくい
メタノール	32.0	やや溶けにくい

＊ 新薬承認情報提供時に置き換え

ラロトレクチニブ硫酸塩の pH 溶解度曲線（室温）



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℃/60%RH	ポリエチレン袋	18又は24ヵ月	安定
加速試験	40℃/75%RH	ポリエチレン袋	6ヵ月	安定
光安定性試験	白色蛍光灯ランプ 紫外照射ランプ	ガラス容器	240万lx･hr 400W･h/m^2	安定

＊ 新薬承認情報提供時に置き換え

2.3.P 製剤*

＜ヴァイトラックビカプセル 25mg、ヴァイトラックビカプセル 100mg＞

組成・性状：

販売名	ヴァイトラックビカプセル 25mg	ヴァイトラックビカプセル 100mg
有効成分	1カプセル中ラロトレクチニブ 25mg 含有（ラロトレクチニブ硫酸塩として30.7mg）	1カプセル中ラロトレクチニブ 100mg 含有（ラロトレクチニブ硫酸塩として122.9mg）
添加剤	カプセル内容物：なし カプセル本体中：ゼラチン、酸化チタン	
性状	乳白色の硬カプセル剤	

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℃/60%RH	ポリエチレン製ボトル、ポリプロピレン製蓋	24ヵ月	安定
	30℃/75%RH		24ヵ月	安定
加速試験	40℃/75%RH		6ヵ月	安定
光安定性試験	白色蛍光灯ランプ 紫外照射ランプ	シャーレ (開放)	240万lx･hr 400W･h/m^2	安定

＜ヴァイトラックビ内用液 20mg/mL＞

組成・性状：

販売名	ヴァイトラックビ内用液 20mg/mL
有効成分	1mL 中ラロトレクチニブ 20.0mg 含有（ラロトレクチニブ硫酸塩として24.6mg）
添加剤	ヒドロキシプロピル-β-シクロデキストリン、スクラロース、クエン酸ナトリウム水和物、無水クエン酸、安息香酸ナトリウム、香料、精製水
性状	無色～黄色又は帯褐色の液

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	2～8℃	褐色ガラス瓶、ポリプロピレン製蓋	12ヵ月	安定
加速試験	25℃/60%RH		12ヵ月	1ヵ月まで安定
光安定性試験	白色蛍光灯ランプ 紫外照射ランプ	石英フラスコ	139万lx･hr 692W･h/m^2	安定

＊ 新薬承認情報提供時に置き換え