2.3　品質に関する概括資料*

緒言

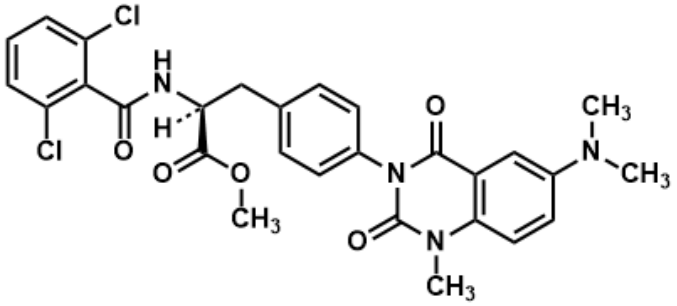
申請医薬品の販売名、剤形等を以下に示す。

販売名	カログラ®錠 120 mg
原薬の一般名	カロテグラストメチル（Carotegrast Methyl）
企業名	EA ファーマ株式会社
剤形	フィルムコーティング錠
含量	1 錠中にカロテグラストメチル 120 mg を含有
投与経路	経口
効能・効果	中等症の潰瘍性大腸炎（5-アミノサリチル酸製剤による治療で効果不十分な場合に限る）

* 新医薬品の承認審査情報公表用に内容を置き換えた。

2.3.S　原薬*

1　名称に関する項目

一般名	（日本名）カロテグラストメチル
	（英名）Carotegrast Methyl
化学名	（日本名） (2*S*)-2-(2,6-ジクロロベンズアミド)-3-{4-[6-(ジメチルアミノ)-1-メチル-2,4-ジオキソ-1,4-ジヒドロキナゾリン-3(2*H*)-イル]フェニル}プロパン酸メチル
	（英名） Methyl (2*S*)-2-(2,6-dichlorobenzamido)-3-{4-[6-(dimethylamino)-1-methyl-2,4-dioxo-1,4-dihydroquinazolin-3(2*H*)-yl]phenyl}propanoate
分子量	569.44
分子式	$C_{28}H_{26}Cl_2N_4O_5$
構造式	
CAS 登録番号	401905-67-7

2　物理化学的性質

項目	結果
性状	淡黄緑色の結晶性の粉末又は塊である
溶解性	*N*-メチルピロリドン又は *N,N*-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、アセトニトリル又はメタノールに溶けにくく、エタノール（99.5）に極めて溶けにくく、1-オクタノール又は水にほとんど溶けない。
吸湿性	25℃/75%RH 及び 25℃/93%RH で 10 日間保存し質量変化を評価した結果、吸湿性が低いことが確認された。
解離定数	pKa＝3.67
分配係数	log P = 0.35（pH 1.2 Clark-Lubs 緩衝液） log P = 2.10（pH 3.0 Britton-Robinson 緩衝液） log P = 3.01（pH 6.1 Britton-Robinson 緩衝液）
旋光度	$[\alpha]_D^{20}$＝ －66° （乾燥後、0.10 g、*N,N*-ジメチルホルムアミド、20 mL、100 mm）

*新医薬品の承認審査情報公表用に内容を置き換えた。

3　安定性

試験		保存条件	容器	保存期間	結果
長期保存試験		25℃／60%RH	ポリエチレン袋／ファイバードラム	36 箇月	変化なし
加速試験		40℃／75%RH	ポリエチレン袋／ファイバードラム	6 箇月	変化なし
苛酷試験	温度（加熱）	60℃／なりゆき湿度	蓋を閉めた褐色ガラス瓶（密栓）	6 箇月	類縁物質の増加
	温湿度	40℃／90%RH	蓋を開けた褐色ガラス瓶（開放）	6 箇月	変化なし
	曝光	25℃／60%RH、2500 lx（D65 ランプ）	15 cm ガラス製皿状容器（曝光）	120 万 lx・hr	類縁物質の増加
			15 cm ガラス製皿状容器をアルミホイルで包む（遮光）		変化なし

4　有効成分の確認試験法

紫外可視吸光度測定法

赤外吸収スペクトル測定法

5　有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

2.3.P　製剤*

1　組成・性状

販売名	カログラ®錠 120 mg
成分・含量	1 錠中にカロテグラストメチル 120 mg を含有
添加剤	メチルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、クロスポビドン、結晶セルロース、部分アルファー化デンプン、D-マンニトール、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン、タルク
性状	白色又は帯黄白色～帯黄緑白色のフィルムコーティング錠

2　安定性

試験		保存条件	容器・包装形態	保存期間	結果
長期保存試験		25℃／60%RH	8 錠／PTP シート×21 シート／アルミ袋（ヒートシール）	48 箇月	類縁物質の増加傾向
加速試験		40℃／75%RH	8 錠／PTP シート×21 シート／アルミ袋（ヒートシール）	6 箇月	類縁物質の増加傾向
苛酷試験	温度	60℃／なりゆき湿度	蓋を閉めた褐色ガラス瓶（密栓）	6 箇月	性状の変化 類縁物質の増加 錠剤硬度の低下
	湿度	30℃／75%RH	蓋を開けた褐色ガラス瓶（開放）	30 日	類縁物質の増加 乾燥減量の増加 溶出率の低下 錠剤硬度の低下 錠剤質量の増加
	光	25℃／60%RH、2500 lx（D65 ランプ）	12 cm シャーレ（曝光）	120 万 lx・hr	類縁物質の増加 錠剤硬度の低下
			12 cm シャーレ、アルミホイル（遮光）		変化なし
	PTP シートのみ	40℃／75%RH	8 錠／PTP シート	6 箇月	類縁物質の増加 溶出率の低下 錠剤硬度の低下 錠剤質量の増加

3　製剤中の有効成分の確認試験法

紫外可視吸光度測定法

4　製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

*新医薬品の承認審査情報公表用に内容を置き換えた。