# 2.3 品質に関する概括資料

## 2.3.S 原薬

1) 名称

(1) INN：belumosudil

(2) JAN

－ 一般名

（日本名）　ベルモスジルメシル酸塩

（英名）　Belumosudil Mesilate

－ 化学名

（日本名）

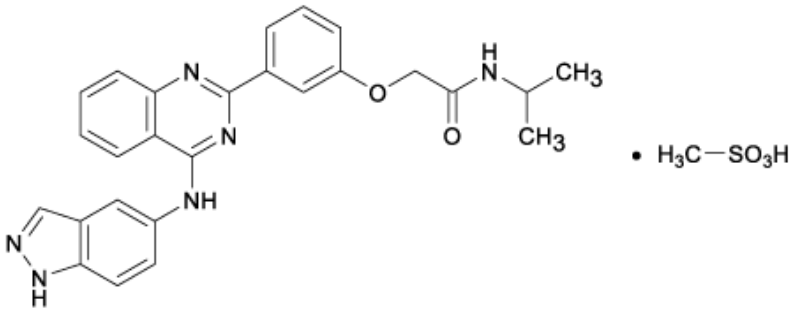
2-(3-{4-[(1*H*-インダゾール-5-イル)アミノ]キナゾリン-2-イル}フェノキシ)-*N*-(プロパン-2-イル)アセトアミド 一メタンスルホン酸塩

（英名）

2-(3-{4-[(1*H*-Indazol-5-yl)amino]quinazolin-2-yl}phenoxy)-*N*-(propan-2-yl)acetamide monomethanesulfonate

2) 構造

(1) 構造式




(2) 分子式：$C_{26}H_{24}N_6O_2$・$CH_4O_3S$

(3) 分子量：548.61

3) 一般特性

(1) 性状

ベルモスジルメシル酸塩は黄色の固体である。

(2) 溶解性

ジメチルスルホキシドにやや溶けにくく、メタノールおよびジメチルホルムアミドに溶けにくく、水およびアセトニトリルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性
僅かに吸湿性がある。

(4) 融点
255～275℃

(5) pKa
1.57、5.33

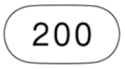
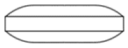
4) 各種条件下における安定性

| 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 | 密閉容器 | 24ヵ月<br>（継続中） | 変化なし |
| 加速試験 | 40℃/75%RH | 密閉容器 | 6ヵ月 | 変化なし |
| 光安定性試験 | 総照度 120 万 lux･h／総近紫外放射エネルギー 200W・h/$m^2$ | 曝光及び遮光 | － | 変化なし |

※承認情報公開時に置き換えた

## 2.3.P 製剤

1) 製剤の外観及び性状

| 販売名 | 剤形 | 色 | 外形 | | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | | 表 | 裏 | 側面 |
| レズロック錠200mg | 楕円形のフィルムコーティング錠 | 微黄色～黄色 |  |  |  |
| | | | 直径（mm） | 厚さ（mm） | 重量（mg） |
| | | | 長径：14.9<br>短径： 7.5 | 5.9 | 525 |

2) 製剤の組成

(1) 有効成分の含量及び添加剤

| 販売名 | 有効成分（1錠中） | 添加剤 |
|---|---|---|
| レズロック錠200mg | ベルモスジルメシル酸塩242.5mg（ベルモスジルとして200mg） | 結晶セルロース、ヒプロメロース、クロスカルメロースナトリウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、酸化チタン、マクロゴール4000、タルク、黄色三二酸化鉄 |

3) 各種条件下における安定性

| 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（乾燥剤入） | 24ヵ月（継続中） | 変化なし |
| 加速試験 | 40℃/75%RH | ポリエチレン製ボトル（乾燥剤入） | 6ヵ月 | 変化なし |
| 光安定性試験 | 総照度120万lux･h／総近紫外放射エネルギー200W・h/$m^2$ | 曝光及び遮光 | － | 変化なし |

※承認情報公開時に置き換えた