2.3　品質に関する概括資料

ネクセラファーマジャパン株式会社

2.3.S　原薬

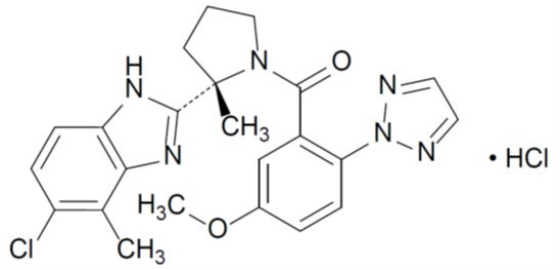
１．名称に関する項目

1.1 一般的名称

JAN（日本名）ダリドレキサント塩酸塩

JAN（英 名）Daridorexant Hydrochloride

1.2　構造式



1.3 分子式及び分子量

分子式：$C_{23}H_{23}ClN_6O_2$・HCl

分子量：487.38

1.4 化学名

[(2*S*)-2-(5-クロロ-4-メチル-1*H*-ベンゾイミダゾール-2-イル)-2-メチルピロリジン-1-イル][5-メトキシ-2-(2*H*-1,2,3-トリアゾール-2-イル)フェニル]メタノン　一塩酸塩

[(2*S*)-2-(5-Chloro-4-methyl-1*H*-benzimidazol-2-yl)-2-methylpyrrolidin-1-yl][5-methoxy-2-(2*H*-1,2,3-triazol-2-yl)phenyl]methanone monohydrochloride

1.5 CAS 登録番号

1505484-82-1 (free base)
1792993-84-0（塩酸塩）

２．原薬に関する項目

2.1 物理化学的性質

性状：本品は、白色から淡黄色の粉末である。

溶解性：ギ酸にやや溶けやすく、エタノールに溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

融点：約 210 ℃（分解）

解離定数：pKa1 = 4.2
　　pKa2 = 12

2.2 安定性

有効成分の各種条件下における安定性*

ダリドレキサント塩酸塩

試験		保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験		25℃／60%RH	60 ヵ月	二重の低密度ポリエチレン袋、ビニールタイで締めて保管	規格内
		30℃／65%RH	60 ヵ月		規格内
加速試験		40℃／75%RH	9 ヵ月		規格内
固体状態での苛酷試験	熱	80℃	7 日間	ガラスバイアル	規格内
	湿度	80℃-75%RH	7 日間	ガラスバイアル	規格内
	光	500W/m^2、総照度 120 万 lx・hr	7 日間	ガラスバイアル	規格内

注）2.3 品質に関する概括資料「2.3.S 原薬」の項を要約して示した。

2.3.P　製剤

１．剤型及び外観

・クービビック®錠 25 mg
　淡紫色～紫色の三角形（径：約7 mm、錠厚：約4 mm）のフィルムコーティング錠
・クービビック®錠 50 mg
　淡橙色～橙色の三角形（径：約 7 mm、錠厚：約 4 mm）のフィルムコーティング錠

２．製剤の組成

販売名	クービビック®錠 25 mg	クービビック®錠 50 mg
有効成分	ダリドレキサント塩酸塩	
分量	1錠中 ダリドレキサント塩酸塩27.02mg （ダリドレキサントとして 25mg）	1錠中 ダリドレキサント塩酸塩54.04mg （ダリドレキサントとして 50mg）
添加剤	D-マンニトール、結晶セルロース、ポビドン、クロスカルメロースナトリウム、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、グリセリン、タルク、酸化チタン、黒酸化鉄、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄＊ ＊：50 mg 錠のみ	

３．製剤の安定性

3.1 クービビック®錠 25 mg

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25℃／60%RH	36 ヵ月	PTP及びアルミピロー	規格内
加速試験	40℃／75%RH	6 ヵ月		規格内
苛酷試験（光）	500W/m^2、総照度 360万lx・hr	33hr	ガラスバイアル （気密容器）	規格内

3.2 クービビック®錠 50mg

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25℃／60%RH	36 ヵ月	PTP及びアルミピロー	規格内
加速試験	40℃／75%RH	6 ヵ月		規格内

注）2.3 品質に関する概括資料「2.3.P 製剤」の項を要約して示した。