ラズクルーズ錠 80 mg，同 240 mg

第２部　CTD の概要

2.3 品質に関する概括資料*

ヤンセンファーマ株式会社

* 新薬承認情報公開時に置き換え

2.3.S　原薬 *

1. 名称

INN：lazertinib

一般的名称（JAN）：（日本名）ラゼルチニブメシル酸塩水和物

（英名）Lazertinib Mesilate Hydrate

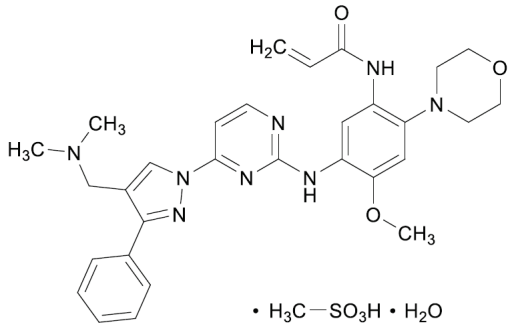
化学名：*N*-{5-[(4-{4-[(Dimethylamino)methyl]-3-phenyl-1*H*-pyrazol-1-yl}pyrimidin-2-yl)amino]-4-methoxy-2-(morpholin-4-yl)phenyl}prop-2-enamide monomethanesulfonate monohydrate

CAS 登録番号：*1903008-80-9* (Lazertinib free base)

2411549-88-5 (Lazertinib mesylate monohydrate)

2. 構造

化学構造式：



分子式：$C_{30}H_{34}N_8O_3$・CH_4O_3S・H_2O

分子量：668.76

3. 一般特性

性状： 白色～淡黄褐色の粉末

融点：約 218°C

溶解性：水　　4.5g/100mL

エタノール　0.70g/100mL

解離定数： pKa_1：2.5（塩基 oxazine）， pKa_2：8.2（塩基 amine）

分配係数： Log P：>4.00（1-オクタノール／水性緩衝液 pH 10.0）

*新薬承認情報公開時に置き換え

4. 安定性

試験名	保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
長期保存試験	25°C/60%RH	二重の低密度ポリエチレン袋+紙製ドラム	36 ヵ月	規格内
加速試験	40°C/75%RH		6 ヵ月	規格内
苛酷試験（光）	曝光	無包装	総照度 120 万 lux・hr 以上及び総近紫外放射エネルギーとして 200 W･h/m^2 以上	規格内

試験項目：性状，類縁物質，水分，含量

2.3.P 製剤 *

1. 剤型及び性状

ラズクルーズ錠 80 mg：黄色の楕円形のフィルムコーティング錠

ラズクルーズ錠 240 mg：赤紫色の楕円形のフィルムコーティング錠

2. 製剤の組成

有効成分の含量

1 錠中に有効成分としてラゼルチニブ 80 mg 又は 240 mg を含有する。

添加剤

疎水性コロイド状シリカ、結晶セルロース、D-マンニトール、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ポリビニルアルコール・ポリエチレングリコール・グラフトコポリマー、タルク、酸化チタン、グリセリン脂肪酸エステル、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、黄色三二酸化鉄[注 1)]、三二酸化鉄[注 2)]、黒酸化鉄[注 2)]

注 1）ラズクルーズ錠 80 mg のみに添加

注 2）ラズクルーズ錠 240 mg のみに添加

3. 安定性

試験名	保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
長期保存試験	25°C/60%RH	PTP 包装（ポリ塩化ビニル／ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム及びアルミニウム箔）	24 ヵ月	規格内
中間的試験	30°C/75%RH		24 ヵ月	規格内
加速試験	40°C/75%RH		6 ヵ月	一部の試験項目で規格外の結果が得られた
苛酷試験（光）	曝光	無包装	総照度 120 万 lux・hr 以上及び総近紫外放射エネルギーとして 200 W･h/m^2 以上	規格内

試験項目： 性状，分解生成物，溶出性，含量等

*新薬承認情報公開時に置き換え