2.3 品質に関する概括資料*

緒言

ハイツエキシン錠 10mg は、有効成分としてリソバリシブメシル酸塩水和物を含むフィルムコーティング錠である。

医薬品の販売名、剤形等を以下に示す。

販売名	ハイツエキシン錠 10mg
原薬の一般名	リソバリシブメシル酸塩水和物
剤形	フィルムコーティング錠
含量	リソバリシブメシル酸塩として 10 mg
投与経路	経口
適応症（効能又は効果）	がん化学療法後に増悪した *PIK3CA* 遺伝子変異を有する卵巣明細胞癌

＊：新薬承認情報提供時に置き換え

2.3.S 原薬

1 一般情報

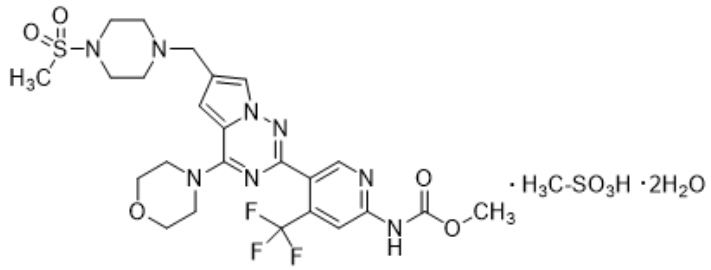
1.1 一般的名称

リソバリシブメシル酸塩水和物 (Risovalisib Mesilate Hydrate)

1.2 化学名

Methyl {5-[6-{[4-(methanesulfonyl)piperazin-1-yl]methyl}-4-(morpholin-4-yl)pyrrolo[2,1-*f*][1,2,4]triazin-2-yl]-4-(trifluoromethyl)pyridine-2-yl}carbamate monomethanesulfonate dihydrate

1.3 構造式



1.4 分子式

$C_{24}H_{29}F_3N_8O_5S \cdot CH_4O_3S \cdot 2H_2O$

1.5 分子量

730.73

2 性状

本品は白色又はほぼ白色の粉末である。

3 安定性

原薬の安定性試験の概要を示す。

試験	保存条件	包装形態	保存期間又は光照射量	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及びラミネート袋（延伸ポリプロピレン/アルミニウム/ポリエチレン）に入れ、紙製ファイバードラムに入れて保管	24 ヵ月（継続中）	規格内の結果であった
加速試験	40°C /75%RH	同上	6 ヵ月	規格内の結果であった
苛酷試験	60°C	無包装	1 ヵ月	水分の結果において試験期間を通じて低い傾向が見られ、粉末 X 線回折の結果において標

試験	保存条件	包装形態	保存期間又は光照射量	結果
				準物質のスペクトルと一致しなかった。その他の試験項目で有意な変化なし
苛酷試験	25°C /90%RH	無包装	1 ヵ月	すべての試験項目で有意な変化なし
光安定性試験	－	無包装	120 万 lux･hr、≧200 W･h/m^2	類縁物質の試験において、新規不純物が検出されたが、試験期間を通じて類縁物質の判定基準を満たした。水分の結果において試験期間を通じて低い傾向が見られ、粉末 X 線回折の結果において標準物質のスペクトルと一致しなかった。その他の試験項目で有意な変化なし

2.3.P 製剤

1 処方

1 錠中に原薬リソバリシブメシル酸塩水和物 10.52 mg（リソバリシブメシル酸塩として 10 mg）を含有する。また、添加剤として乳糖水和物、部分アルファー化デンプン、軽質無水ケイ酸、クロスポビドン、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、黄色三二酸化鉄を含む。

2 性状

本品は淡黄色～黄色のカプセル形のフィルムコーティング錠である。

3 安定性

製剤の安定性試験の概要を示す。

試験	保存条件	包装形態	保存期間又は光照射量	結果
長期保存試験	25°C /60%RH	ブリスター	18 ヵ月（継続中）	規格内の結果であった
加速試験	40°C /75%RH	同上	6 ヵ月	規格内の結果であった
苛酷試験	40°C	無包装	1 ヵ月	すべての試験項目で有意な変化なし
	60°C	同上	1 ヵ月	類縁物質の顕著な増加と水分の減少が認められた。その他の試験項目で有意な変化なし
	92.5%RH	同上	1 ヵ月	水分の増加が認められた。その他の試験項目で有意な変化なし
	75%RH	同上	1 ヵ月	水分の増加が認められた。その他の試験項目で有意な変化なし
光安定性試験	－	同上	120 万 lux･hr 200 W･hr/m^2	すべての試験項目で有意な変化なし