第 2 部　CTD の概要

一般名：カミゼストラント

2.3　品質に関する概括資料[注)]
エトカマ®錠

本資料に記載された情報に係る権利はアストラゼネカ株式会社に帰属します。弊社の事前の承諾なく本資料の内容を他に開示することは禁じられています。

注）「2.3 品質に関する概括資料」を新薬承認情報提供時に置き換え

2.3.S 原薬

一般的名称（JAN）：

（日本名）カミゼストラント、（英名）Camizestrant

化学名（JAN）：

（日本名）

N-[1-(3-フルオロプロピル)アゼチジン-3-イル]-6-[(6*S*,8*R*)-8-メチル-7-(2,2,2-トリフルオロエチル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-3*H*-ピラゾロ[4,3-*f*]イソキノリン-6-イル]ピリジン-3-アミン

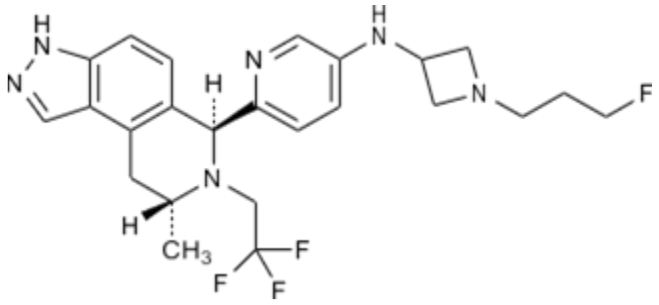
（英名）

N-[1-(3-Fluoropropyl)azetidin-3-yl]-6-[(6*S*,8*R*)-8-methyl-7-(2,2,2-trifluoroethyl)-6,7,8,9-tetrahydro-3*H*-pyrazolo[4,3-*f*]isoquinolin-6-yl]pyridin-3-amine

CAS 登録番号：

2222844-89-3

化学構造：



分子式：

$C_{24}H_{28}F_4N_6$

分子量：

476.51

性状：

本薬は白色～褐色の粉末である。

溶解性：

各種溶媒における溶解度

溶媒	1g を溶かすのに要する溶媒量 (mL)	日本薬局方の溶解度表記
エタノール	1～10	溶けやすい
水	1000～10000	極めて溶けにくい

各種 pH 溶媒に対する溶解度

条件	溶解性(mg/mL)
pH 1.2 (人工胃液)	≥1.2
pH 4.5 (酢酸塩緩衝液)	≥1.2
pH 6.8 (リン酸塩緩衝液)	1.1
pH 12 (水酸化ナトリウム水溶液)	0.07

吸湿性：

本薬は非吸湿性である。

熱分析：

本薬は約 132°C で融解する。

解離定数（pKa）：

本薬の pKa は 4.8 及び 8.4 であった。

分配係数：

本薬の分配係数（log D）は pH 7.4 において 2.3 であった。

安定性：

試験	保存条件			保存形態	保存期間	結果
	温度	湿度	光			
長期保存試験	25℃	60%RH	―	ポリエチレン袋／アルミニウム袋／硬質容器	24 箇月	規格内
中間的試験	30℃	75%RH	―		24 箇月	規格内
加速試験	40℃	75%RH	―		6 箇月	規格内
苛酷試験	50℃	成り行き湿度	―		3 箇月	規格内
	―	―	曝光	無包装	総照度 120 万 lx·hr 及び総近紫外放射エネルギー400 W·h/m^2	規格内

試験項目：性状、含量及び純度試験（有機不純物）

2.3.P　製剤

組成及び性状

販売名	エトカマ錠 75 mg
有効成分	1 錠中カミゼストラント 75 mg
剤形・性状	明るい灰みの黄赤色の円形のフィルムコーティング錠
添加剤	結晶セルロース、無水リン酸水素カルシウム、デンプングリコール酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ポリビニルアルコール（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、三二酸化鉄、黒酸化鉄

安定性

試験	保存条件			保存形態	保存期間	結果
	温度	湿度	光			
長期保存試験	25°C	60%RH	—	PTP 包装 [a]	24 箇月	規格内
中間的試験	30°C	75%RH	—	PTP 包装 [a]	24 箇月	規格内
加速試験	40°C	75%RH	—	PTP 包装 [a]	6 箇月	規格内
苛酷試験	50°C	成り行き湿度	—	PTP 包装 [a]	1 箇月	規格内
	40°C	75%RH	—	無包装	1 箇月	規格内
	30°C	75%RH	—	無包装	3 箇月	規格内
	25°C	60%RH	—	無包装	9 箇月	規格内
	—	—	曝光	無包装	総照度 120 万 lx·hr 以上及び総近紫外放射エネルギー200 W·h/m^2 以上	規格内

試験項目：性状、含量、分解生成物、崩壊性

[a]　アルミニウムラミネート、アルミニウム箔