2.3.S* 原薬（レボドパ）

1 名称

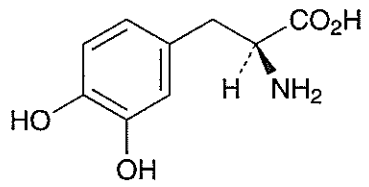
(1) JAN

（日本名）レボドパ （英名）Levodopa

(2) 化学名

3-Hydroxy-L-tyrosine

(3) 構造



分子式：$C_9H_{11}NO_4$
分子量：197.19

2 一般特性

(1) 性状

白色又はわずかに灰色を帯びた白色の結晶又は結晶性の粉末で，においはない。

(2) 溶解性

ギ酸に溶けやすく，水に溶けにくく，エタノール（95）にほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。

(3) 吸湿性

80%RH で 24 時間保管するとき，ごくわずかに吸湿性を示す。

(4) 融点

融点　約 275℃（分解）

(5) 解離定数（pKa）

pKa 2.3，8.7，9.7 及び 13.4（25℃）

(6) 分配係数

log P －2.4（オクタノール/水）

(7) その他の主な示性値

立体異性体：S 型であり，左旋性を有する。
旋光度：$[\alpha]_D^{20}$ －11.5～－13.0°（乾燥後，2.5g，1mol/L 塩酸試液，50mL，100mm）
吸光度：$E_{1cm}^{1\%}$（280nm） 136～146（乾燥後，30mg，0.001mol/L 塩酸試液，1000mL）
pH：飽和水溶液の pH は 5.0～6.5 である。

3 安定性

試験	温度	湿度	光	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	30℃	65%RH	暗所	直接容器：二重のポリエチレン製袋（低密度ポリエチレン）に入れて結束 二次容器：プラスティック製ドラム（高密度ポリエチレン）	開始時，3，6，9，12，18，24，36，48[a]，60 ヵ月	変化なし
加速試験	40℃	75%RH	暗所		開始時，1，2，3，4，6 ヵ月	変化なし

a. 48 ヵ月まで終了

2.3.S * 原薬（カルビドパ水和物）

1 名称

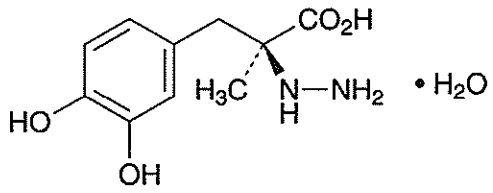
(1) JAN

（日本名）カルビドパ水和物 （英名）Carbidopa Hydrate

(2) 化学名

(2S)-2-(3,4-Dihydroxybenzyl)-2-hydrazinopropanoic acid monohydrate

(3) 構造



分子式：$C_{10}H_{14}N_2O_4 \cdot H_2O$
分子量：244.24

2 一般特性

(1) 性状

白色～帯黄白色の粉末である。

(2) 溶解性

メタノールにやや溶けにくく，水に溶けにくく，エタノール（95）に極めて溶けにくく，ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

相対湿度 80%に 24 時間保存するとき，わずかに吸湿性を示す。

(4) 融点

約 179℃（分解）

* 新薬承認情報提供時に置き換え

(5) 解離定数（pKa）

pKa 7.91（文献値）

(6) 分配係数

- 2.71（文献値）

(7) その他の主な示性値

立体異性体：2S 型であり，左旋性を有する。
結晶多形：一水和物である.
旋光度：［α］$^{20}_{D}$ −21.0〜−23.5° （1g，塩化アルミニウム（Ⅲ）試液，100mL，100mm）

3 安定性

試験	温度	湿度	光	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	30℃	65%RH	暗所	直接容器：二重のポリエチレン製袋（低密度ポリエチレン）に入れて結束 二次容器：プラスティック製ドラム（高密度ポリエチレン）	開始時，3，6，9，12，18，24，36 [a]，48，60 ヵ月	変化なし
加速試験	40℃	75%RH	暗所		開始時，1，2，3，4，6 ヵ月	変化なし

a. 36 ヵ月まで終了

2.3.P * 製剤

1 製剤の組成

(1) 有効成分の含量

日局 レボドパ 2000mg，日局 カルビドパ水和物 500mg（カルビドパとして 463mg）（1 カセット 100mL 中）

(2) 添加物

カルメロースナトリウム

2 安定性

試験	温度	湿度	光	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	−20℃	-	暗所	医療用カセット（ポリ塩化ビニル製の薬液バッグがポリカーボネート製カセットに格納されている）	開始時，3，6，9，12，18，24 ヵ月	変化なし
	5℃	-	暗所		開始時，4，8，12，15 週	変化なし
加速試験	25℃	60%RH	暗所		開始時，8，12，16，24 時間	変化なし
					開始時，1，2，3，4，7，9，14 日	外観の変化，分解物の増加，含量の低下を認めた
苛酷試験（光）	5℃	-	総照度：31 万 lux・h 以上，総近紫外放射エネルギー：200W・h/m^2 以上	ガラス容器（密栓）対照はカセット	3 日（31 万 lux・h 以上）	外観の変化，分解物の増加，粘度及び含量の低下を認めた
				カセット 対照はカセット	3 日（31 万 lux・h 以上）	変化なし[a]
				カセット＋箱 対照はカセット＋箱	3 日（31 万 lux・h 以上）	変化なし

a. 規格値内であったが，カセット容器のみでは分解生成物の増加，粘度の低下が認められた