2.3.S 原薬[a]

(1) 名称

INN：Apremilast

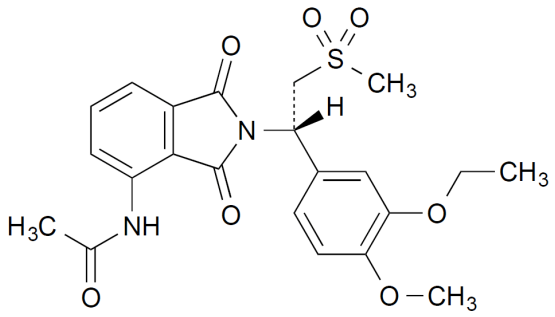
JAN：（日本名）アプレミラスト（英名）Apremilast

(2) 化学名

（和名）
N-{2-[(1*S*)-1-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-(メチルスルホニル)エチル]-1,3-ジオキソ-2,3-ジヒドロ-1*H*-イソインドール-4-イル}アセトアミド
（英名）
N-{2-[(1*S*)-1-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-(methylsulfonyl)ethyl]-1,3-dioxo-2,3-dihydro-1*H*-isoindol- 4-yl}acetamide

(3) 構造式，分子式及び分子量

構造式：



分子式： $C_{22}H_{24}N_2O_7S$
分子量： 460.50

(4) 物理的化学的性質

性状：本品は白色から淡黄色の粉末である。

比旋光度：アプレミラストは*N*-{2-[(1*S*)-1-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル)-2-(メチルスルホニル)エチル]-1,3-ジオキソ-2,3-ジヒドロ-1*H*-イソインドール-4-イル}アセトアミドの*S*-エナンチオマーであり、比旋光度はアセトニトリル溶液中(20 mg/mL)で+28.1°である。

溶解性：アセトニトリル、アセトン、テトラヒドロフラン、2-ブタノン、ジクロロメタンに溶けにくく，酢酸エチル、酢酸n-ブチル、メタノール、無水エタノール、t-ブチルメチルエーテルに極めて溶けにくく，トルエン、2-プロパノール、1-ブタノール、ヘプタンにほとんど溶けない.

融点：約 156°C

分配係数（1-オクタノール/水）：*P*=1.77

(5) 安定性

試験	保存条件	保存形態	保存期間
長期保存試験	25±2°C/60±5%RH	二重 LDPE*袋+HDPE†容器	24 箇月
加速試験	40±2°C/75±5%RH	二重 LDPE 袋+HDPE 容器	6 箇月
光安定性試験	総照度：240 万 lux・hr 総近紫外放射エネルギー：420 W・h/m^2	試料：本品 対照：本品＋遮光（アルミホイル）	規定の総照度及び総近紫外放射エネルギーまで

*LDPE：低密度ポリエチレン
†HDPE：高密度ポリエチレン

1) 長期保存試験及び加速試験

全ての保存期間において，性状に変化はなく，類縁物質は規格の範囲内で，新規の類縁物質及び強制分解試験により検出された分解物は認められなかった。また，含量も規格の範囲内であった。

2) 光安定性試験

光を照射しても分解物及び含量低下は認められず，光に対して安定であった。

a：2.3.S 原薬の項は新薬情報提供時に置き換えた。

2.3.P　製剤[b]

(1)　製剤及び処方

販売名	オテズラ錠 10mg	オテズラ錠 20mg	オテズラ錠 30mg
成分・含量（1 錠中）	アプレミラスト 10mg 含有	アプレミラスト 20mg 含有	アプレミラスト 30mg 含有
添加物	結晶セルロース、乳糖水和物、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（部分けん化物）、酸化チタン、マクロゴール 4000、タルク、三二酸化鉄	結晶セルロース、乳糖水和物、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（部分けん化物）、酸化チタン、マクロゴール 4000、タルク、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄	結晶セルロース、乳糖水和物、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（部分けん化物）、酸化チタン、マクロゴール 4000、タルク、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、黒酸化鉄
色・剤形	淡赤色のフィルムコーティング錠	褐色のフィルムコーティング錠	淡褐色のフィルムコーティング錠

(2)　安定性

試験	保存条件	保存形態	保存期間
長期保存試験	30±2°C/60±5%RH	PTP シート(PVC)	36 箇月
加速試験	40±2°C/75±5%RH	PTP シート(PVC)	6 箇月
光安定性試験	白色灯（400-750 nm）で150 時間（240 万 lux・hr）曝光した。また、試料を紫外光（315-400 nm）で15 時間（420 W・h/m^2）曝光した。	無包装	規定の総照度及び総近紫外放射エネルギー以上まで

1) 長期保存試験及び加速試験

長期保存試験及び加速試験は性状，類縁物質，溶出性及び定量値に大きな変化は認められず，いずれも設定した規格に適合した。

2) 光安定性試験

全ての試料において，対照と比較して性状，類縁物質，溶出性及び定量値に変化は認められず， 光に対して安定であった。

b：2.3.P　　製剤の項は新薬情報提供時に置き換えた。