2.3.S　原薬

(1) 名称

INN：bedaquiline

一般的名称（JAN）：（日本名）ベダキリンフマル酸塩

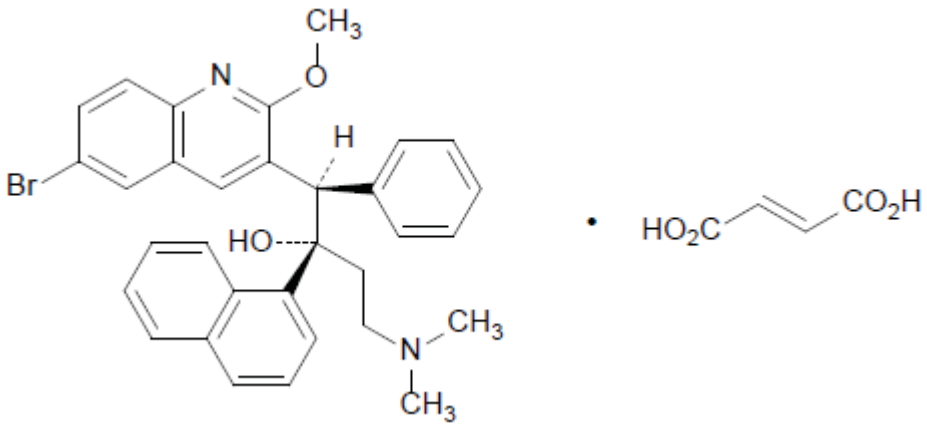
（英名）Bedaquiline Fumarate

化学名：(1*R*,2*S*)-1-(6-Bromo-2-methoxyquinolin-3-yl)-4-(dimethylamino)-2-(naphthalen-1-yl)-1-phenylbutan-2-ol monofumarate

CAS 登録番号：*845533-86-0*

(2) 構造

化学構造式：



分子式：$C_{32}H_{31}BrN_2O_2 \cdot C_4H_4O_4$

分子量：671.58

(3) 一般特性

性状：白色の粉末

溶解性：水 0.007（g/100mL）

エタノール 2.4（g/100mL）

2-プロパノール 0.64（g/100mL）

メタノール 14（g/100mL）

アセトニトリル 0.38（g/100mL）

融点：210℃（分解）

分配係数：1-オクタノール/水： 低溶解性のため測定せず

酸塩基解離定数：pK_{a1}：9 付近，pK_{a2}：1 付近（いずれも類縁体の測定値より外挿して算出）

(4) 安定性（ベダキリンフマル酸塩）

試験項目	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	48 ヵ月	二重の低密度ポリエチレン袋に袋詰めしカードボードドラムに入れる	変化なし
加速試験	40°C/75%RH	6 ヵ月		粒子径のわずかな増加

測定項目:性状，類縁物質，粒子径，含量

2.3.P 製剤

(1) 剤形

白色の素錠

(2) 製剤の組成

有効成分の含量：

1 錠中にベダキリンフマル酸塩を 120.89mg（ベダキリンとして 100mg）含有

添加物：

乳糖水和物，結晶セルロース，トウモロコシデンプン，クロスカルメロースナトリウム，ヒプロメロース，ステアリン酸マグネシウム，軽質無水ケイ酸，ポリソルベート 20

(3) 安定性

試験項目	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	36 ヵ月	PTP（延伸ポリアミド/アルミニウム/ポリ塩化ビニルフィルム及び紙/アルミニウム）包装	変化なし
加速試験	40°C/75%RH	6 ヵ月		変化なし

試験項目：性状，分解生成物，溶出性，含量