2.3.S　原薬

1. 名称

化学名：

({(2*R*,3*R*)-3-[4-(4-Cyanophenyl)thiazol-2-yl]-2-(2,4-difluorophenyl)-1-(1*H*-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-yl}oxy)methyl dihydrogen phosphate mono[(2*S*)-2,6-diaminohexanoic acid] monoethanolate（JAN）

一般的名称：

（日本名）ホスラブコナゾール　L－リシンエタノール付加物（JAN）

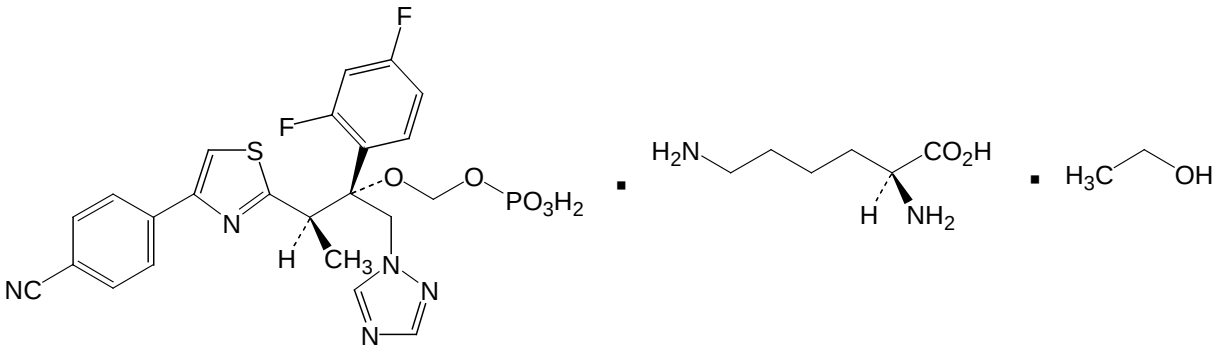
（英名）Fosravuconazole L-Lysine Ethanolate（JAN）

登録番号：

914361-45-8

2. 構造

化学構造：



分子式：$C_{23}H_{20}F_2N_5O_5PS \cdot C_6H_{14}N_2O_2 \cdot C_2H_6O$

分子量：739.73

3. 物理化学的性質

（1）外観・性状

白色～黄色の粉末である。

（2）溶解性

水に溶けやすく、アセトニトリル、メタノール、*N*－メチルピロリドン、エタノール(99.5)、1－オクタノール又は酢酸エチルにほとんど溶けない。また、pH5 Briton-Robinson 緩衝液、pH7 Briton-Robinson 緩衝液、pH9 Briton-Robinson 緩衝液、及び pH11 Briton-Robinson 緩衝液に溶けやすく、pH3 Briton-Robinson 緩衝液にやや溶けやすく、0.1 mol/L 塩酸にほとんど溶けない。

（3）吸湿性

25℃/75%RH で 1 週間保存したとき、吸湿性が認められた。

（4）融点（分解点）、沸点、凝固点

融点（分解点）：148～156℃

（5）酸塩基解離定数

pKa：＜3 及び 5.9

（6）分配係数

1－オクタノール/水、pH7.0 のとき-0.53

（7）その他の主な示性値

pH：5.2

旋光度〔α〕$_{D}^{20}$：＋6.6°（50 mg、水、5 mL、100 mm）

4. 有効成分の各種条件下における安定性

試験項目		保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験		5℃	ポリエチレン袋（二重）＋アルミニウムラミネート袋	24 ヵ月	安定
加速試験		25℃/60% RH		6 ヵ月	安定
苛酷試験	光安定性	キセノンランプ 25℃/60% RH	石英製容器	総照度 120 万 lux・hr 以上、総近紫外放射エネルギー 200W・hr/m^2 以上	外観において、僅かな脱色が見られた。
	高温	60℃	ポリエチレン袋（二重）＋アルミニウムラミネート袋	4 週間	分解生成物の増加が認められた。
	高湿	25℃/75% RH	開封した遮光ガラス瓶	1 週間	外観において、固まった粉末となった。また、エタノール含量、水分及び含量において、変化が認められた。

5. 有効成分の確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法

6. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

「2.3.S　原薬」を新薬承認情報提供時に置き換えた。

2.3.P　製剤

1. 組成

1 カプセル中にホスラブコナゾール　L-リシンエタノール付加物 169.1 mg を含有する。（ラブコナゾールとして 100 mg）

2. 性状

キャップ部は赤色及びボディ部は黄色の 3 号硬カプセルで、内容物は白色～黄色の粉末である。

3. 安定性

試験		保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験		25℃/60%RH	PTP（ポリプロピレン/アルミニウム）＋アルミピロー	36 ヵ月	安定
加速試験		40℃/75%RH	PTP（ポリプロピレン/アルミニウム）＋アルミピロー	6 ヵ月	安定
苛酷試験	光安定性	キセノンランプ 25℃/60%RH	シャーレ開放	総照度 120 万 lux・hr 以上、総近紫外放射エネルギー 200 W・hr/m^2 以上	安定

4. 溶出性

溶出試験法（パドル法）

5. 製剤中の有効成分の確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法

6. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

「2.3.P　製剤」を新薬承認情報提供時に置き換えた。