ベオーバ錠 50mg

(ビベグロン)

第 2 部　CTD の概要(サマリー)

2.3　品質に関する概括資料

杏林製薬株式会社

2.3.S　原薬*

1.　名称

ビベグロン

国際一般名(rINN)　：vibegron

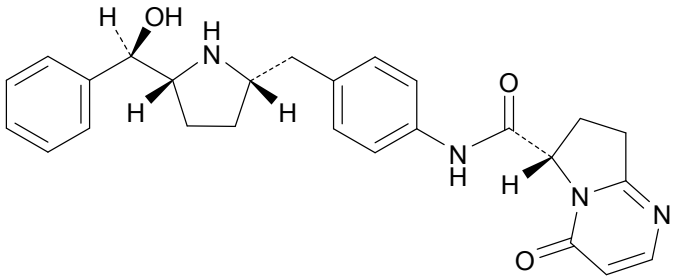
日本医薬品一般名称(JAN)　：ビベグロン

化学名　：(6*S*)-*N*-[4-({(2*S*,5*R*)-5-[(*R*)-Hydroxy(phenyl)methyl]pyrrolidin-2-yl}methyl)phenyl]-4-oxo-4,6,7,8-tetrahydropyrrolo[1,2-*a*]pyrimidine-6-carboxamide

CAS 登録番号　：*1190389-15-1*

2.　構造

構造式　：



分子式　：$C_{26}H_{28}N_4O_3$

分子量　：444.53

立体化学　：ビベグロンは 4 箇所の不斉中心を有し、ピロロピリミジン部位の 6 位が *S* 配置、ピロリジン部位の 2 位が *S* 配置、ピロリジン部位の 5 位が *R* 配置、ヒドロキシメチルフェニル部位の不斉中心が *R* 配置となる単一の光学活性化合物である。

3.　一般特性

性状　：白色～微黄白色又は灰白色の粉末

溶解性　：各種溶媒に対する溶解度(25°C±2°C)

溶媒	溶解度(mg/mL)
メタノール	15.2
エタノール(99.5)	3.70
2-プロパノール	1.11
1-オクタノール	0.637
アセトニトリル	1.03
水	0.0889
0.1 mol/L 塩酸	43.3
0.2 mol/L 水酸化ナトリウム	0.151

各種 pH の McIlvaine 緩衝液に対する溶解度(25°C±2°C)

pH (McIlvaine 緩衝液)	溶解度(mg/mL)
3.0	37.2
4.0	30.0
5.0	29.5
6.0	19.4
7.0	5.21
8.0	0.597

pH　：9.1 (飽和水溶液)
分配係数　：1-オクタノール/pH 7.0 の McIlvaine 緩衝液(25°C±2°C)の系における分配比は、0.550 であった。
比旋光度$[\alpha]_D^{20}$：−100.7° (メタノール溶液)
融点　：208°C
吸湿性　：なし
酸解離定数　：8.9

4. 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°C/60%RH	ポリエチレン袋(二重) +ファイバードラム	24 箇月	安定 (継続中)
加速試験		40°C/75%RH	ポリエチレン袋(二重) +ファイバードラム	6 箇月	安定
苛酷試験	温度	60°C	褐色ガラス瓶(密栓)	3 箇月	安定
	湿度	30°C/75%RH	シャーレ(開放)	3 箇月	安定
	光	25°C/60%RH D65 ランプ	シャーレ [a]	120 万 lx·h	類縁物質増加 (規格外)

a：ポリ塩化ビニリデンフィルムで覆い、小穴を空けて保存した。

2.3.P　製剤*

1. 製剤の組成

販売名	ベオーバ錠 50mg
成分・含量	1 錠中にビベグロンとして 50 mg 含有
添加剤	D-マンニトール、結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、乳糖水和物、ヒプロメロース、酸化チタン、トリアセチン、黄色三二酸化鉄、青色 2 号アルミニウムレーキ、カルナウバロウ

2. 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°C/60%RH	PTP[a]+アルミラミネート袋+紙箱	24 箇月	安定 (継続中)
加速試験		40°C/75%RH	PTP[a]+アルミラミネート袋+紙箱	6 箇月	安定
苛酷試験	温度	50°C	PTP[a]+アルミラミネート袋+紙箱	3 箇月	安定
	湿度	30°C/75%RH	無包装	3 箇月	安定
			PTP[a]	3 箇月	安定
	光	25°C/60%RH D65 ランプ	無包装	120 万 lx·h	安定

a：PTP 包装(片面ポリプロピレンフィルム、片面アルミニウム箔)

*「2.3 品質に関する概括評価」を新薬承認情報提供時に本項と置き換えた。