ソホスブビル／ベルパタスビル配合錠

第 2 部 CTD の概要

2.3 品質に関する概括資料

ギリアド・サイエンシズ株式会社

2.3.S　　原薬*

1. JAN

（日本名）
ソホスブビル（JAN）
ベルパタスビル（JAN）

（英名）
Sofosbuvir（JAN）
Velpatasvir（JAN）

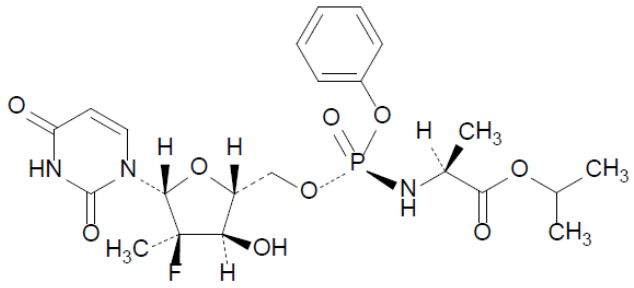
2. 化学名

ソホスブビル
1-Methylethyl *N*-[(*S*)-{[(2*R*,3*R*,4*R*,5*R*)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydropyrimidin-1(2*H*)-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl]methoxy}phenoxyphosphoryl]-L-alaninate

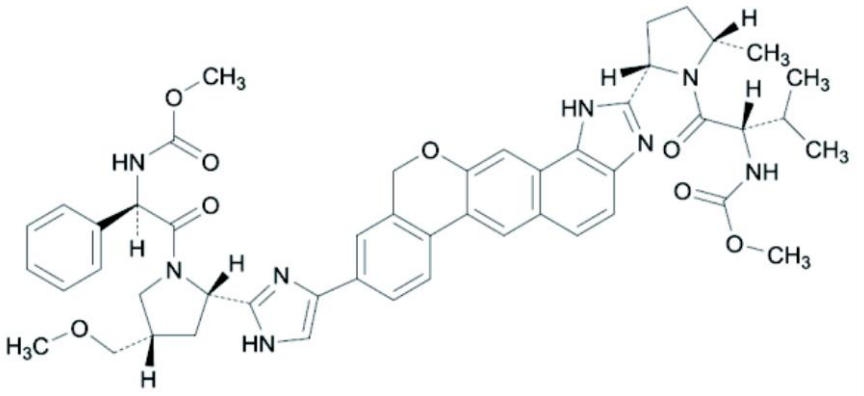
ベルパタスビル
Methyl{(2*S*)-1-[(2*S*,5*S*)-2-(9-{2-[(2*S*,4*S*)-1-{(2*R*)-2-[(methoxycarbonyl)amino]-2-phenylacetyl}-4-(methoxymethyl)pyrrolidin-2-yl]-1*H*-imidazol-4-yl}-1,11-dihydro[2]benzopyrano[4',3':6,7]naphtho[1,2-*d*]imidazol-2-yl)-5-methylpyrrolidin-1-yl]-3-methyl-1-oxobutan-2-yl}carbamate

3. 構造式

ソホスブビル



ベルパタスビル



*「2.3.S 原薬」を新薬承認情報提供時に置き換え

4. 分子式及び分子量

ソホスブビル
分子式：$C_{22}H_{29}FN_3O_9P$
分子量：529.45

ベルパタスビル
分子式：$C_{49}H_{54}N_8O_8$
分子量：883.0

5. 性状

ソホスブビル
白色から微黄白色の粉末

ベルパタスビル
白色から黄褐色又は黄色の固体

6. 融点

ソホスブビル
融点：約 125℃

ベルパタスビル
融点：非晶質であり特定の融点はない。

7. 溶解性

ソホスブビル

メタノール、アセトン、アセトニトリル又はエタノール（99.5）に溶けやすく、2-プロパノールにやや溶けやすく、酢酸エチルにやや溶けにくく、トルエン、ジクロロメタン又はヘプタンにほとんど溶けない。

ベルパタスビル

アセトン又はエタノール（95）に溶けやすく、アセトニトリル、ジクロロメタン、酢酸エチル又はメタノールにやや溶けやすく、トルエンにやや溶けにくく、2-プロパノールに溶けにくい。

*「2.3.S 原薬」を新薬承認情報提供時に置き換え

2.3.P　　製剤*

1. 組成

1 錠中ソホスブビル 400 mg、ベルパタスビル 100 mg 含有

2. 添加物

結晶セルロース、コポリビドン、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

3. 性状

ピンク色のひし形のフィルムコーティング錠

4. 安定性

試 験		保存条件	保存期間	保存形態	結　果
長期保存試験		30℃/75%RH	18ヵ月※	PTP 包装	水分の増加が認められたが規格の範囲内であったその他の試験項目は変化なし
加速試験		40℃/75%RH	6ヵ月	PTP 包装	水分の増加が認められたが規格の範囲内であったその他の試験項目は変化なし
苛酷試験	温度	－20℃	4日	75 mL の白色高密度ポリエチレン製容器／未開封	変化なし
		60℃	4日		変化なし
	光	総照度120万 lx･hr 以上及び総近紫外放射エネルギー 200 W･hr/m²以上照射		ガラスシャーレ無包装（曝光）／アルミニウム包装（遮光）	変化なし

試験項目：性状、類縁物質、水分、微生物限度（長期保存試験のみ）、溶出性、含量
※：継続中

*「2.3.P 製剤」を新薬承認情報提供時に置き換え