2.3.S 原薬 *

1. 名称

INN：apalutamide

一般的名称（JAN）：（日本名）アパルタミド

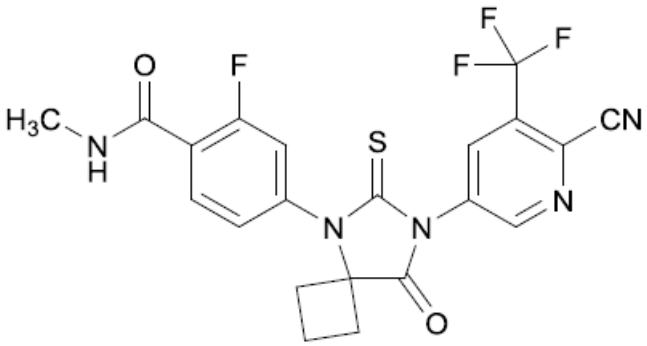
（英名）Apalutamide

化学名：4-{7-[6-Cyano-5-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]-8-oxo-6-thioxo-5,7-diazaspiro[3.4]octan-5-yl}-2-fluoro-N-methylbenzamide

CAS 登録番号：956104-40-8

2. 構造

化学構造式：



分子式：$C_{21}H_{15}F_4N_5O_2S$

分子量：477.43

3. 一般特性

性状：白色～淡黄色の粉末

融点：約 194～196°C

溶解性：アセトニトリルに溶けやすく，エタノールにやや溶けにくく，水にほとんど溶けない。

解離定数：pKa：9.7

分配係数：Log P = 2.89（1-オクタノール/pH 7.0 リン酸塩緩衝液）

4. 安定性

試験名	保存条件	保存期間	包装形態	試験結果
長期保存試験	25°C/60%RH	18 ヵ月	二重の低密度ポリエチレン袋+ファイバードラム	変化なし
加速試験	40°C/75%RH	6 ヵ月		変化なし
苛酷試験（光）	曝光		無包装	変化なし

試験項目：性状，類縁物質，水分，含量，微生物限度（長期保存試験のみ）等

*新薬承認情報提供時に置き換え

2.3.P 製剤 *

1. 剤型及び性状

淡黄緑色～灰緑色のフィルムコーティング錠

2. 製剤の組成

有効成分の含量：

1 錠中にアパルタミド 60 mg 含有

添加剤：

ヒプロメロース酢酸エステルコハク酸エステル，軽質無水ケイ酸，クロスカルメロースナトリウム，結晶セルロース，ケイ酸処理結晶セルロース，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，黄色三二酸化鉄，黒酸化鉄

3. 安定性

試験名	保存条件	保存期間	包装形態	試験結果
長期保存試験	25°C/60%RH	24 ヵ月	PTP 包装	変化なし
加速試験	40°C/75%RH	6 ヵ月		変化なし
苛酷試験（光）	曝光		無包装	変化なし

試験項目：性状，分解生成物，溶出性，水分，含量，微生物限度（長期保存試験のみ）等

*新薬承認情報提供時に置き換え