ステボロニン点滴静注バッグ 9000 mg/ 300 mL
に関する資料

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はステラファーマ株式会社にあります。
当該製品の適正使用の目的以外の営利目的に本資料を利用することはできません。

ステラファーマ株式会社

2.3 品質に関する概括評価

ステラファーマ株式会社

2.3.S　原薬

1. 名称

（1） 国際一般名（INN）

borofalan (^{10}B)

（2） 化学名（IUPAC）

日本名：(*S*)-2-アミノ-3-[4-(^{10}B)ジヒドロキシボラニルフェニル]プロパン酸

英名：(*S*)-2-Amino-3-[4-(^{10}B)dihydroxyboranylphenyl]propanoic acid

（3） 一般的名称（JAN）

ボロファラン（^{10}B）

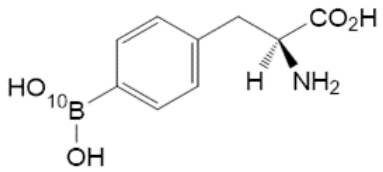
（4） CAS 登録番号

80994-59-8

2. 構造

ボロファラン（^{10}B）は ^{10}B 濃縮ホウ酸から合成された L-フェニルアラニン誘導体である。ボロファラン（^{10}B）の構造を次に示す。

化学構造



分子式：$C_9H_{12}{}^{10}BNO_4$

分子量：208.21

3. 物理的化学的性質

ボロファラン（^{10}B）の物理的化学的性質を次に示す。

（1） 性状

ボロファラン（^{10}B）は白色の結晶性の粉末である。

（2） 溶解性

各種溶媒及び各種 pH 緩衝液に対する溶解性を表 1 及び表 2 に示す。

表 1　　各種溶媒に対する溶解性

溶媒	ボロファラン（^{10}B）1 g を溶かすのに要する溶媒量（mL）	溶解性
水	10000 以上	ほとんど溶けない
エタノール(99.5)	10000 以上	ほとんど溶けない
ギ酸	1～10	溶けやすい

表 2　　Britton-Robinson 広域緩衝液に対する溶解性

水溶液の pH	飽和溶液の濃度（mg/mL）	溶解性
2	1.36	溶けにくい
4	0.63	極めて溶けにくい
6	0.60	極めて溶けにくい
8	0.72	極めて溶けにくい
10	1.82	溶けにくい

（3） 吸湿性

90%RH での水分吸着量は約 0.05%であり、吸湿性は認められなかった。

（4） 融点及び熱分析

融点は 239.5℃（分解）であった。

（5） 解離定数（pKa）

pKa1（アミノ基）は 9.66 であった。pKa2（ホウ酸）は求めることができなかった。

（6） 分配係数

ボロファラン（^{10}B）の分配係数を表 3 に示す。

表 3　　ボロファラン（^{10}B）の分配係数

	Britton-Robinson 広域緩衝液					水
	pH 2	pH 4	pH 6	pH 8	pH 10	
分配係数（Log P）	-2.14	-1.74	-1.74	-1.87	-[a]	-1.76

[a] 1-オクタノール層の濃度が 0.00 μg/mL であり、Log P は求められなかった。

4. 安定性

ボロファラン（^{10}B）は温度、湿度、光の影響を受けず、長期保存試験（25℃/60%RH）で保存した場合、60 箇月安定であった。加速試験（40℃/75%RH）においても 6 箇月間安定であった。

試験	保存条件			保存形態	保存期間	結果
	温度	湿度	光			
長期保存試験	25°C	60%RH	暗所	低密度ポリエチレン袋：二重容器：ファイバードラム	60 箇月	60 箇月まで安定（規格内）
加速試験	40°C	75%RH	暗所	低密度ポリエチレン袋：二重容器：ファイバードラム	6 箇月	6 箇月まで安定（規格内）

*2.3.S　原薬の項をまとめて示した。

2.3.P　製剤

1. 組成

本剤は 1 容器中に次の成分を含有する点滴静注用製剤である。

販売名	ステボロニン点滴静注バッグ 9000 mg/300 mL
有効成分	ボロファラン（^{10}B）　9000 mg
添加剤	D-ソルビトール　9450 mg
	亜硫酸水素ナトリウム　60 mg
	pH 調節剤　適量
容器及び施栓系	容器（ソフトバッグ）：ポリエチレン 施栓系：ポリブタジエンゴム 外袋：ポリエチレンテレフタレート／ナイロン／ポリエチレン製 脱酸素剤

2. 物理的化学的及び生物学的性質

本剤の物理的化学的性質を次に示す。

（1） 性状

無色～微黄色澄明の液である。

（2） pH

pH　7.4～7.8

（3） 浸透圧比

浸透圧比　1.0～1.5

3. 安定性

長期保存試験では脱酸素剤を封入した遮光機能のある外袋で 2 次包装を施した本剤は、42 箇月間安定であった。加速試験（25°C/60%RH）においても 6 箇月間安定であった。

試験		保存条件			保存形態	保存期間	結果
		温度	湿度	光			
長期保存試験		5°C	成り行き	暗所	半透過性容器／脱酸素剤を封入した遮光機能ありの外袋	42 箇月	42 箇月まで安定（規格内）
加速試験		25°C	60%RH	暗所	半透過性容器／脱酸素剤を封入した遮光機能ありの外袋	6 箇月	6 箇月まで安定（規格内）
苛酷試験	光	成り行き	成り行き	D65 ランプ照射（2000 lx）	外袋なし（半透過性容器）	120 万 lx·hr	類縁物質増加（規格外）
					外袋あり（半透過性容器／脱酸素剤を封入した遮光機能ありの外袋）		120 万 lx·hr まで安定（規格内）

*2.3.P　製剤の項をまとめて示した。