リカムビス水懸筋注 600mg
リカムビス水懸筋注 900mg

第２部　CTD の概要
2.3 品質に関する概括資料*

ヤンセンファーマ株式会社

* 新薬承認情報公開時に置き換え

2.3.S　原薬 *

1. 名称

INN：rilpivirine

一般的名称（JAN）：（日本名）リルピビリン

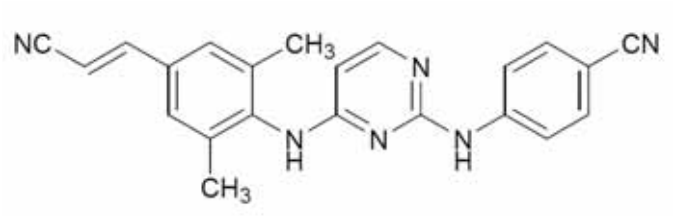
（英名）Rilpivirine

化学名：4-{[4-({4-[(1*E*)-2-Cyanoethenyl]-2,6-dimethylphenyl}amino)pyrimidin-2-yl]amino}benzonitrile

CAS 登録番号：500287-72-9

2. 構造

化学構造式：



分子式：$C_{22}H_{18}N_6$

分子量：366.42

3. 一般特性

性状：白色～淡黄色の粉末

融点：約 244°C

溶解性：*N, N*-ジメチルホルムアミド　32 g/100 mL

エタノール　0.098 g/100 mL

水　<0.001 g/100 mL

解離定数：pKa：5.6

分配係数：log P>4.16（1-オクタノール/pH 9 ホウ酸-塩化カリウム-水酸化ナトリウム緩衝液）

4. 安定性

試験名	保存条件	包装形態	保存期間	試験結果
長期保存試験	25°C/60%RH	二重の低密度ポリエチレン袋＋アルミラミネート袋	24 ヵ月	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	総照度 120 万 lux・hr 以上	不純物の増加が見られたが，規格内

試験項目：性状，類縁物質，水分，含量

*新薬承認情報公開時に置き換え

2.3.P 製剤 *

1. 剤型及び性状

白色の懸濁性注射剤

2. 製剤の組成

販売名		リカムビス水懸筋注 600mg	リカムビス水懸筋注 900mg
有効成分		（1 バイアル中） リルピビリン 600 mg/2 mL	（1 バイアル中） リルピビリン 900 mg/3 mL
添加剤	ポロキサマー338	100 mg	150 mg
	ブドウ糖水和物	38.50 mg	57.75 mg
	リン酸二水素ナトリウム一水和物	4 mg	6 mg
	クエン酸水和物	2 mg	3 mg
	水酸化ナトリウム	1.732 mg	2.598 mg

3. 安定性

試験名	保存条件	包装形態	保存期間	試験結果
長期保存試験	5°C	ガラスバイアル，ゴム栓	36 カ月	変化なし
加速試験	25°C/60%RH		6 カ月	粒度分布の変化及び放出性の低下が認められた
苛酷試験（光）	曝光		総照度 120 万 lux・hr 以上	変化なし

試験項目：性状，粒度分布，含量，分解生成物，放出性，不溶性微粒子（長期保存試験及び加速試験のみ），pH（長期保存試験及び加速試験のみ），無菌（長期保存試験及び加速試験のみ）

*新薬承認情報公開時に置き換え