2.3.S.　原薬（カボテグラビル）[1]

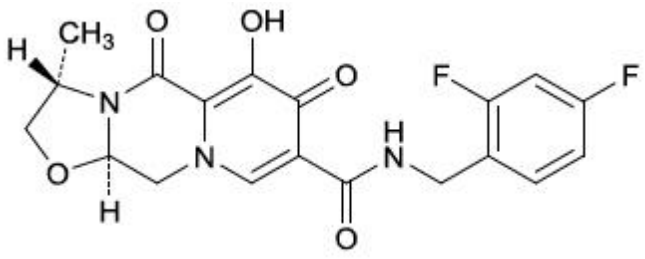
一般的名称

JAN：　（日本名）カボテグラビル

（英名）　Cabotegravir

化学名：　(3S,11aR)-N-[(2,4-Difluorophenyl)methyl]-6-hydroxy-3-methyl-5,7-dioxo-2,3,5,7,11,11ahexahydrooxazolo[3,2-a]pyrido[1,2-d]pyrazine-8-carboxamide（IUPAC）

化学構造



分子式

$C_{19}H_{17}F_2N_3O_5$

分子量

405.35

有効成分の各種条件下における安定性

試験区分		保存条件	保存期間	保存形態	測定項目	結果
長期保存試験		30℃、75%RH	48 箇月	ポリエチレン袋	性状 含量 類縁物質 光学異性体 ジアステレオマー 水分 結晶形	規格内
加速試験		40℃、75%RH	6 箇月	ポリエチレン袋		規格内
苛酷試験	温度	50℃、成り行き湿度	3 箇月	ポリエチレン袋		規格内
	温度・湿度	40℃、75%RH	3 箇月	無包装		規格内
	凍結/融解	-20℃/30℃	1 箇月	ポリエチレン袋		規格内
	光	総照度：120 万 lx･h 以上 総放射エネルギー： 200 W･h/m^2 以上		無包装		規格内

[1] インタビューフォームを要約して示した。

2.3.S.　原薬（カボテグラビルナトリウム）[1]

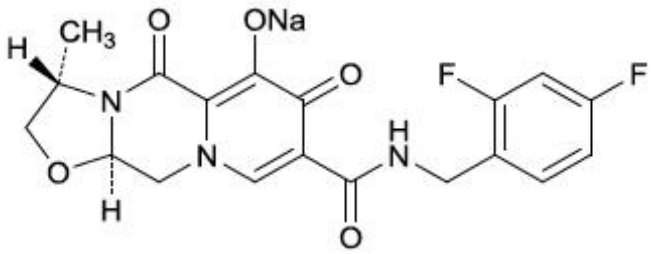
一般的名称

JAN：　（日本名）カボテグラビルナトリウム

（英名）　Cabotegravir Sodium

化学名：　Monosodium(3S,11aR)-8-{[(2,4-difluorophenyl)methyl]carbamoyl}-3-methyl-5,7-dioxo-2,3,5,7,11,11a-hexahydrooxazolo[3,2-a]pyrido[1,2-d]pyrazin-6-olate（IUPAC）

化学構造



分子式

$C_{19}H_{16}F_2N_3NaO_5$

分子量

427.33

有効成分の各種条件下における安定性

試験区分		保存条件	保存期間	保存形態	測定項目	結果
長期保存試験		30℃、75%RH	48 箇月	ポリエチレン袋	性状 含量 類縁物質 光学異性体 ジアステレオマー 水分 粒子径 結晶形	規格内
加速試験		40℃、75%RH	6 箇月	ポリエチレン袋		規格内
苛酷試験	温度	50℃、成り行き湿度	3 箇月	ポリエチレン袋		規格内
	温度・湿度	40℃、75%RH	3 箇月	無包装		規格内
	凍結/融解	-20℃/30℃	1 箇月	ポリエチレン袋		規格内
	光	総照度：120 万 lx･h 以上 総放射エネルギー： 200 W･h/m^2 以上		無包装		規格内

[1] インタビューフォームを要約して示した。

2.3.P.　製剤（ボカブリア水懸筋注 600mg、ボカブリア水懸筋注 400mg）[1]

1.　組成及び性状

（1）有効成分（活性成分）の含量

ボカブリア水懸筋注 600mg

1 バイアル（3mL）中にカボテグラビル 600.0mg を含有する。

ボカブリア水懸筋注 400mg

1 バイアル（2mL）中にカボテグラビル 400.0mg を含有する。

（2）添加物

ボカブリア水懸筋注 600mg

D－マンニトール（105.0mg）、ポリソルベート 20（60.0mg）、マクロゴール 4000（60.0mg）

ボカブリア水懸筋注 400mg

D－マンニトール（70.0mg）、ポリソルベート 20（40.0mg）、マクロゴール 4000（40.0mg）

（3）性状

振り混ぜるとき、白色～淡紅色の均質な懸濁液である

[1] インタビューフォームを要約して示した。

2. 製剤の各種条件下における安定性

400mg/2mL 及び 600mg/3mL

<table>
<tr><th colspan="2">試験区分</th><th>保存条件</th><th>保存期間</th><th>保存形態</th><th>測定項目</th><th>結果</th></tr>
<tr><td colspan="2">長期保存試験</td><td>5℃、成り行き湿度
30℃、75%RH</td><td>36 箇月</td><td rowspan="2">ガラスバイアル
（密栓、倒立）
/紙箱</td><td rowspan="7">性状
含量
類縁物質
粒子径
pH
溶出性</td><td>規格内</td></tr>
<tr><td colspan="2">加速試験</td><td>40℃、75%RH</td><td>6 箇月</td><td>規格内</td></tr>
<tr><td rowspan="4">苛酷試験</td><td>温度</td><td>50℃、成り行き湿度</td><td>3 箇月</td><td>ガラスバイアル
（密栓、倒立）
/紙箱</td><td>規格内</td></tr>
<tr><td rowspan="2">凍結/融解</td><td rowspan="2">-20℃/30℃</td><td rowspan="2">1 箇月</td><td>ガラスバイアル
（密栓、倒立）
/紙箱</td><td rowspan="2">性状、含量、粒子径は規格外であった 。</td></tr>
<tr><td>ガラスバイアル
（密栓、正立）
/紙箱</td></tr>
<tr><td>光</td><td colspan="2">総照度：120 万 lx· h 以上
総放射エネルギー：200 W· h/m^2 以上</td><td>ガラスバイアル
（密栓、横倒し）</td><td>規格内</td></tr>
</table>

2.3.P.　製剤（ボカブリア錠 30mg）[1]

1.　組成及び性状

（1）有効成分（活性成分）の含量

1 錠中にカボテグラビルナトリウム 31.62mg（カボテグラビルとして 30mg）を含有する。

（2）添加物

乳糖水和物、結晶セルロース、ヒプロメロース、デンプングリコール酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、酸化チタン、マクロゴール 400

（3）性状

フィルムコーティング錠

2.　製剤の各種条件下における安定性

試験区分		保存条件	保存期間	保存形態	測定項目	結果
長期保存試験		5℃、成り行き湿度 30℃、75%RH	36 箇月	ポリエチレン製容器、ポリプロピレン製キャップ	性状 類縁物質 溶出性 含量	規格内
加速試験		40℃、75%RH	6 箇月			規格内
苛酷試験	温度	50℃、成り行き湿度	3 箇月			規格内
	凍結/融解	-20℃/30℃	1 箇月			規格内
	光	総照度：120 万 lx· h 以上 総放射エネルギー：200 W· h/m^2 以上		無包装		規格内

[1] インタビューフォームを要約して示した。