2.3.S　　原薬（ホスレボドパ）[1]

1. 名称

（1）INN
foslevodopa

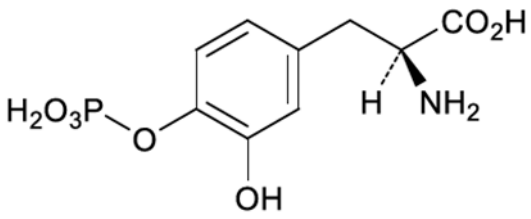
（2）化学名
（日本名）3-ヒドロキシ-*O*-ホスホノ-L-チロシン
（英名）3-Hydroxy-*O*-phosphono-L-tyrosine

（3）JAN
（日本名）ホスレボドパ
（英名）Foslevodopa

（4）CAS 登録番号
97321-87-4

2. 構造

（1）構造式



分子式：$C_9H_{12}NO_7P$
分子量：277.17

1 ホスレボドパ「2.3.S 原薬」の項を要約して示した

3. 物理的化学的性質

（1）外観・性状

白色～微黄白色の結晶性の粉末又は塊を含む粉末

（2）溶解性

種々の pH 溶液でのホスレボドパの溶解性（25°C）

溶解後の pH	溶解度（mg/mL）
0.06	27.33
0.24	21.79
0.54	16.31
0.85	14.22
1.10	12.82
1.43	12.46
1.86	13.92
2.25	18.67
2.73	42.05
3.26	140.1
3.67	420.6
3.78	564.1
3.89	644.1
4.05	717.4

（3）吸湿性

吸湿性を示さない

（4）融点

約 217.8°C（分解）

（5）解離定数

pKa = 0.7，2.2，4.8，9.5 及び 11.6

（6）分配係数

-9.75 未満（1-オクタノール／緩衝液 [pH7.4]）

4. 安定性試験

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	ポリエチレン袋（二重）／ポリエチレン容器	24 ヵ月	規格内
	30°C/65%RH		24 ヵ月	
加速試験	40°C/75%RH		6 ヵ月	規格内
苛酷試験	50°C/75%RH		0.5 ヵ月	規格内
光安定性試験	総照度 120 万 lx·h 以上，総近紫外放射エネルギー 200 W·h/m^2 以上	石英容器	－	規格内

測定項目：性状，純度試験，定量等

2.3.S 原薬（ホスカルビドパ水和物）[2]

1. 名称

（1）INN
foscarbidopa

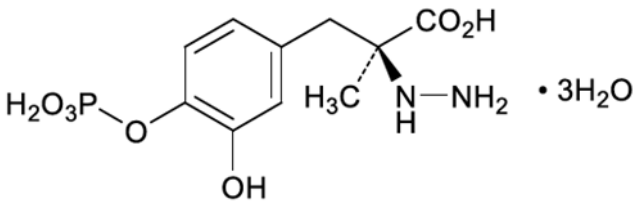
（2）化学名
（日本名）(2*S*)-2-ヒドラジニル-3-[3-ヒドロキシ-4-(ホスホノオキシ)フェニル]-2-メチルプロパン酸 三水和物
（英名）(2*S*)-2-Hydrazinyl-3-[3-hydroxy-4-(phosphonooxy)phenyl]-2-methylpropanoic acid trihydrate

（3）JAN
（日本名）ホスカルビドパ水和物
（英名）Foscarbidopa Hydrate

（4）CAS 登録番号
2407648-70-6

2. 構造

（1）構造式



分子式：$C_{10}H_{15}N_2O_7P•3H_2O$（三水和物）
分子量：360.25（三水和物）

2 ホスカルビドパ水和物「2.3.S 原薬」の項を要約して示した

3. 物理的化学的性質

（1）外観・性状

白色～淡黄色の結晶性の粉末又は塊を含む粉末

（2）溶解性

種々の pH 溶液でのホスカルビドパ水和物の溶解性（25°C）

溶解後の pH	溶解度（mg/mL）
0.23	27.68
0.56	17.40
0.89	12.95
1.13	10.75
1.47	10.23
1.91	10.02
2.47	23.72
2.75	37.84
3.28	79.88
3.41	138.5

（3）吸湿性

結晶水を超える吸湿性はない.

（4）融点

約 153°C

（5）解離定数

pKa = 0.8，2.2，4.9，7.5 及び 11.7

（6）分配係数

-9.02 未満（1-オクタノール／緩衝液 [pH7.4]）

4. 安定性試験

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	5°C	ポリエチレン袋（二重）	18 ヵ月	規格内
加速試験	25°C/60%RH		6 ヵ月	規格内
苛酷試験	30°C/75%RH		1.5 ヵ月	規格内
光安定性試験	総照度 120 万 lx·h 以上，総近紫外放射エネルギー 200 W·h/m^2 以上	石英容器	－	規格内

測定項目：性状，純度試験，定量等

2.3.P 製剤[3]

1. 剤形

注射剤（バイアル）

2. 性状

無色～黄色又は褐色の澄明な液で、赤み若しくは紫みを帯びる又は僅かに乳白光を発することもある.

3. 組成

有効成分：10 mL 中にホスレボドパ 2400 mg 及びホスカルビドパ 120 mg（無水物として）を含有する.

添加剤：水酸化ナトリウム，塩酸

4. 安定性試験

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	5°C	ガラスバイアル	18 ヵ月	規格内
加速試験	25°C/60%RH	ガラスバイアル	6 ヵ月	規格内
光安定性試験	総照度 120 万 lx·h 以上，総近紫外放射エネルギー 200 W·h/m^2 以上	ガラスバイアル	－	規格内
		ガラスバイアル／紙箱		

測定項目：性状，純度試験，定量等

3 「2.3.P 製剤」の項を要約して示した