レナカパビル

第２部（モジュール２）CTD の概要（サマリー）

2.3 品質に関する概括資料

ギリアド・サイエンシズ株式会社

2.3.S　原薬※

1．JAN

（1）和名

レナカパビルナトリウム（JAN）

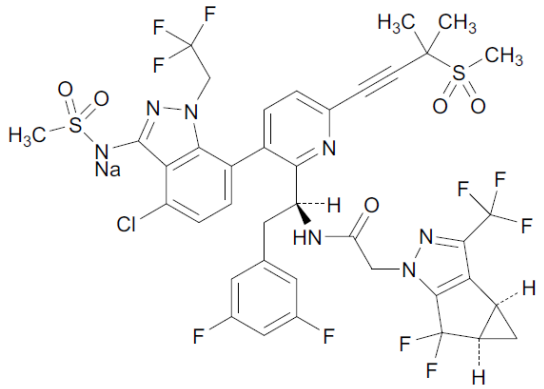
（2）英名

Lenacapavir Sodium（JAN）

2．化学名

Monosodium[4-chloro-7-{2-[(1*S*)-1-{2-[(3b*S*,4a*R*)-5,5-difluoro-3-(trifluoromethyl)-3b,4,4a,5-tetrahydro-1*H*-cyclopropa[3,4]cyclopenta[1,2-*c*]pyrazol-1-yl]acetamido}-2-(3,5-difluorophenyl)ethyl]-6-[3-(methanesulfonyl)-3-methylbut-1-yn-1-yl]pyridin-3-yl}-1-(2,2,2-trifluoroethyl)-1*H*-indazol-3-yl](methanesulfonyl)azanide（JAN）

3．構造式



4．分子式及び分子量

分子式：$C_{39}H_{31}ClF_{10}N_7NaO_5S_2$

分子量：990.26

5．性状

淡黄色～黄色の固体

6．融点

融点：約 228℃

7．溶解性

N,N-ジメチルホルムアミド、メタノール、*N*-メチル-2-ピロリドン、マクロゴール 300、アセトン又はジメチルスルホキシドに溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けにくく、エタノールに溶けにくく、2-プロパノール又はジクロロメタンに極めて溶けにくい。

※「2.3.S 原薬」を新薬承認情報提供時に置き換え

2.3.P　　製剤※（シュンレンカ皮下注 463.5 mg）

1．組成

1.5mL 中にレナカパビルナトリウム 473.1 mg（レナカパビルとして 463.5 mg）含有

2．添加物

マクロゴール 300、注射用水

3．性状

黄色澄明の液で、たやすく検出される不溶性異物を認めない

4．安定性

試験		保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験		30℃／75%RH	24 ヵ月	ガラスバイアル	規格内
加速試験		40℃／75%RH	6 ヵ月	ガラスバイアル	規格内
苛酷試験	温度	－20℃	1 ヵ月	ガラスバイアル	規格内
		5℃／なりゆき湿度	12 ヵ月	ガラスバイアル	規格内
		50℃／なりゆき湿度	2 週間	ガラスバイアル	規格内
		温度サイクル*		ガラスバイアル	規格内
	光	総照度120万 lx・hr 以上及び 総近紫外放射エネルギー 200 W・hr/m^2 以上照射		ガラスバイアル＋ 紙箱 (無包装／ アルミニウム包装)	規格内

試験項目　性状（外観）、定量法、類縁物質、粘度、不溶性微粒子、無菌試験／包装完全性（長期保存試験）、包装完全性（苛酷試験（温度））

＊　－20℃及び 40℃/75%RH で各 24 時間のサイクルを 5 サイクル実施した。

※「2.3.P 製剤」を新薬承認情報提供時に置き換え

2.3.P　　製剤※（シュンレンカ錠 300 mg）

1．組成

1 錠中レナカパビルナトリウム 306.8 mg（レナカパビルとして 300 mg）含有

2．添加物

D-マンニトール、結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、コポビドン、ステアリン酸マグネシウム、ポリオキシエチレン（196）ポリオキシプロピレン（67）グリコール、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、三二酸化鉄

3．性状

淡褐色のフィルムコーティング錠

4．安定性

試験		保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験		30℃／75%RH	36 ヵ月	PTP シート（乾燥剤入り、ホイル袋で密封*）	規格内
加速試験		40℃／75%RH	6 ヵ月	PTP シート（乾燥剤入り、ホイル袋で密封*）	規格内
苛酷試験	温度	－20℃	1 ヵ月	PTP シート（乾燥剤入り、ホイル袋で密封*）	規格内
		50℃／なりゆき湿度	2 週間	PTP シート（乾燥剤入り、ホイル袋で密封*）	規格内
	光	総照度120万 lx・hr 以上及び総近紫外放射エネルギー 200 W・hr/m^2 以上照射		ガラスシャーレ（無包装／アルミニウム包装）	水分の増加が認められたが、いずれの項目も規格内であった

試験項目　性状（外観）、水分、定量法、類縁物質、溶出性

＊　5 錠入り PTP シートを乾燥剤 3 g とともにホイル袋で密封した。

※「2.3.P 製剤」を新薬承認情報提供時に置き換え