タピナロフ

第 2 部 CTD の概要（サマリー）
2.3 品質に関する概括資料 *

日本たばこ産業株式会社

*：「2.3 品質に関する概括資料」を新薬承認情報公開時に本資料に置き換えた。

2.3 緒言

申請医薬品の概要は下記のとおりである。

申請区分	医療用医薬品 (1)新有効成分含有医薬品
販売名	ブイタマークリーム 1%
一般名（JAN）	タピナロフ（英名：Tapinarof）
含量	1 g 中にタピナロフを 10 mg 含有する
投与経路	一般外用剤
効果・効能	アトピー性皮膚炎 尋常性乾癬
用法・用量	＜アトピー性皮膚炎＞ 通常，成人及び 12 歳以上の小児には，1 日 1 回，適量を患部に塗布する。 ＜尋常性乾癬＞ 通常，成人には，1 日 1 回，適量を患部に塗布する。

2.3.S 原薬

1 名称

(1) 一般的名称（JAN）

（日本名）：タピナロフ

（英名）：Tapinarof

(2) 化学名

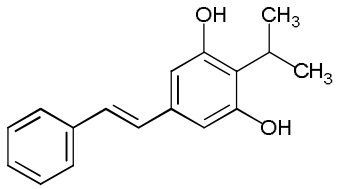
5-[(1*E*)-2-Phenylethen-1-yl]-2-(propan-2-yl)benzene-1,3-diol

(3) CAS 登録番号

79338-84-4

2 構造

(1) 化学構造



(2) 分子式

$C_{17}H_{18}O_2$

(3) 分子量

254.32

3 一般特性

(1) 外観・性状

白色～微褐色の粉末

(2) 溶解性

各種溶媒における溶解度

溶媒	タピナロフ 1 g を 溶かすのに要する溶媒量	溶解性
エタノール（99.5）	1 mL 未満	極めて溶けやすい
ジメチルスルホキシド	1 mL 以上 10 mL 未満	溶けやすい
水	10,000 mL 以上	ほとんど溶けない

(3) 吸湿性

吸湿性は認められなかった。

(4) 融点

148.3℃

(5) 解離定数（pKa）

$pKa_1 = 10.0$，$pKa_2 = 12.5$

(6) 分配係数

Log P = 5.1（1-オクタノール／リン酸塩緩衝液 pH 7.0）

4 安定性

試験項目：性状（外観），純度試験（類縁物質），水分，粉末 X 線回折，定量法

試験区分		温度	湿度	光	保存形態	保存期間	試験結果
長期保存試験		30°C	75%RH		内：ポリエチレン二重袋 外：ポリエチレン容器	60 ヵ月 （継続中）	規格内
加速試験		40°C	75%RH		内：ポリエチレン二重袋 外：ポリエチレン容器	6 ヵ月	規格内
苛酷試験	温度	50°C	制御せず		内：ポリエチレン二重袋 外：ポリエチレン容器	3 ヵ月	規格内
苛酷試験	光	25°C	60%RH	白色蛍光ランプ及び近紫外蛍光ランプ	石英ガラスシャーレ	総照度： 120 万 lx· hr （総近紫外放射エネルギー： 200 W· h/m^2 以上）	外観の変化 （規格外）， 類縁物質の増加 （規格外）， 定量値の低下 （規格外）
					石英ガラスシャーレ （アルミホイルで被覆） （対照として保存）		規格内

2.3.P 製剤

1 剤形及び性状

白色のクリーム

2 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の分量

クリーム 1 g 中にタピナロフを 10 mg 含有する

(2) 添加物

プロピレングリコール，ポリソルベート 80，安息香酸，クエン酸ナトリウム水和物，エデト酸ナトリウム水和物，クエン酸水和物，精製水，中鎖脂肪酸トリグリセリド，ジブチルヒドロキシトルエン，セトステアリルアルコール，ポリソルベート 60，ジエチレングリコールモノエチルエーテル，ポリオキシエチレン（2）ステアリルエーテル，ポリオキシエチレン（20）ステアリルエーテル

3 安定性

試験項目：性状（外観），pH，純度試験（分解生成物），微生物限度，定量法（含量）

試験区分	温度	湿度	保存形態	保存期間	測定結果
長期保存試験	25°C	60%RH	アルミラミネートチューブ	継続中	規格内
加速試験	40°C	75%RH	アルミラミネートチューブ	6 ヵ月	規格内
中間的試験	30°C	65%RH	アルミラミネートチューブ	12 ヵ月	規格内