2.3.S 原薬 [1]

1. 名称

医薬品一般的名称（JAN）：日本名：アトゲパント水和物，英名：Atogepant Hydrate

国際一般名（INN）：Atogepant

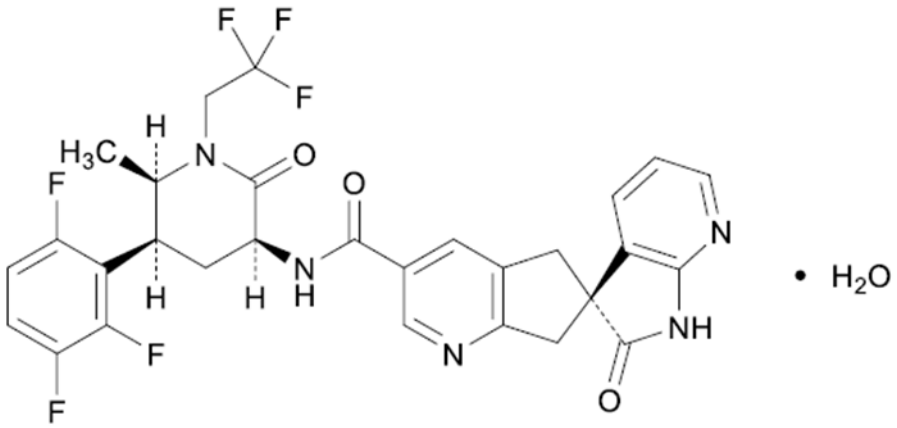
化学名：
（日本名）
(3'S)-N-[(3S,5S,6R)-6-メチル-2-オキソ-1-(2,2,2-トリフルオロエチル)-5-(2,3,6-トリフルオロフェニル)ピペリジン-3-イル]-2'-オキソ-1',2',5,7-テトラヒドロスピロ[シクロペンタ[b]ピリジン-6,3'-ピロロ[2,3-b]ピリジン]-3-カルボキシアミド　一水和物

（英名）
(3'S)-N-[(3S,5S,6R)-6-Methyl-2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroethyl)-5-(2,3,6-trifluorophenyl)piperidin-3-yl]-2'-oxo-1',2',5,7-tetrahydrospiro[cyclopenta[b]pyridine-6,3'-pyrrolo[2,3-b]pyridine]-3-carboxamide monohydrate

CAS 番号：　1488325-98-9

2. 構造

化学構造式：



1 2.3 品質に関する概括資料「2.3.S 原薬」の項を要約して示した

分子式：$C_{29}H_{25}F_6N_5O_4$（水和物として）
分子量：621.53

3. 物理化学的性質

（1） 外観・性状
白色～淡灰白色の粉末

（2） 溶解性
各種溶媒中のアトゲパント水和物の溶解性（25°C）

溶媒	1 g を溶かすのに要する溶解量（mL）	日本薬局方の溶解性
エタノール	> 100	溶けやすい
メタノール	72.7	やや溶けやすい
アセトン	24.8	やや溶けにくい
アセトニトリル	6.33	溶けにくい
水	0.0045	ほとんど解けない

（3） 吸湿性
相対湿度 95%，重量増加は 0.1%以下であり，吸湿性は認められなかった。

（4） 融点（分解点），沸点，凝固点
融解開始 144°C，融解ピーク約 175°C

（5） 酸塩基解離定数
pKa：2.2（ピリジン），10.2（ラクタム）

（6） 分配係数
1-オクタノール／水におけるアトゲパント水和物の分配係数：2.4

（7） その他の主な示性値
旋光度：$[\alpha]_{365}^{25}$：–60°（メタノール）

4. 安定性

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	低密度ポリエチレンバッグ	48 箇月	規格内であった
加速試験	40°C/75%RH		6 箇月	
光安定性試験	総照度 120 万 lux・hr 以上，総近紫外放射エネルギー200 W・h/m^2 以上	ペトリ皿（無包装）	NA	規格内であった

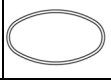
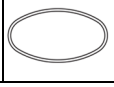
測定項目：性状，純度試験（1）類縁物質，水分，定量法

2.3.P 製剤 [2]

1. 剤形

素錠

2. 外観及び性状

販売名	アクイプタ錠 60mg			アクイプタ錠 30mg			アクイプタ錠 10mg		
色・形状	白色～微黄白色の楕円形の素錠						白色～微黄白色の円形の素錠		
外観	上面	下面	側面	上面	下面	側面	上面	下面	側面
									
大きさ	長径：約 16mm 短径：約 9mm 厚さ：約 6mm			長径：約 14mm 短径：約 7mm 厚さ：約 4mm			直径：約 6mm 厚さ：約 4mm		
識別コード	A60			A30			A10		

3. 組成

販売名	アクイプタ 60mg	アクイプタ錠 30mg	アクイプタ錠 10mg
有効成分	1 錠中アトゲパント水和物（無水物として） 60mg	1 錠中アトゲパント水和物（無水物として） 30mg	1 錠中アトゲパント水和物（無水物として）10mg
添加剤	コポビドン，コハク酸 d-α-トコフェロールポリエチレングリコール，D-マンニトール，結晶セルロース，塩化ナトリウム，クロスカルメロースナトリウム，軽質無水ケイ酸，フマル酸ステアリルナトリウム		

2 2.3 品質に関する概括資料「2.3.P 製剤」の項を要約して示した

4. 安定性

＜アクイプタ錠 60mg＞

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	PTP 包装	36 箇月	規格内であった
加速試験	40°C/75%RH		6 箇月	規格内であった
温度サイクル試験	3 サイクル（各サイクル:－20°C で 2 日間，25°C /60%RH で 2 日間，50°C で 2 日間，及び 25°C /60%RH で 2 日間）		NA	規格内であった
光安定性	総照度 120 万 lux・hr 以上，総近紫外放射エネルギー200 W・h/m^2 以上	ペトリ皿（無包装）	NA	規格内であった

測定項目：性状，純度試験　類縁物質，水分，溶出性，定量法

＜アクイプタ錠 30mg＞

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	PTP 包装	36 箇月	規格内であった
加速試験	40°C/75%RH		6 箇月	規格内であった
光安定性	総照度 120 万 lux・hr 以上，総近紫外放射エネルギー200 W・h/m^2 以上	ペトリ皿（無包装）	NA	規格内であった

測定項目：性状，純度試験　類縁物質，水分，溶出性，定量法

＜アクイプタ錠 10mg＞

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	PTP 包装	36 箇月	規格内であった
加速試験	40°C/75%RH		6 箇月	規格内であった
温度サイクル試験	3 サイクル（各サイクル:－20°C で 2 日間，25°C /60%RH で 2 日間，50°C で 2 日間，及び 25°C /60%RH で 2 日間）		NA	規格内であった
光安定性	総照度 120 万 lux・hr 以上，総近紫外放射エネルギー200 W・h/m^2 以上	ペトリ皿（無包装）	NA	規格内であった

測定項目：性状，純度試験　類縁物質，水分，溶出性，定量法