目次

2.3.S　原薬 2
Ⅰ. 名称に関する項目 2
1. 販売名 2
2. 一般名 2
3. 本質 2
4. 分子式及び分子量 2
5. 化学名（命名法） 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 2
7. CAS 登録番号 3
Ⅱ. 有効成分に関する項目 3
1. 物理化学的性質 3
2. 有効成分の各種条件下における安定性 3
3. 有効成分の確認試験法 3
4. 有効成分の定量法 3
2.3.P　製剤 4
Ⅰ. 製剤に関する項目 4
1. 剤形 4
2. 製剤の組成 4
3. 注射剤の調製法 5
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 5
5. 製剤の各種条件下における安定性 5
6. 溶解後の安定性 5
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化） 5
8. 生物学的試験法 5
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 5
10. 製剤中の有効成分の定量法 5
11. 力価 5
12. 混入する可能性のある夾雑物 6
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 6
14. その他 6

2.3.S　原薬

Ⅰ．名称に関する項目

1. 販売名

（1）和名

レパーサ皮下注 140 mg シリンジ
レパーサ皮下注 140 mg ペン

（2）洋名

Repatha SC Injection 140 mg Syringe
Repatha SC Injection 140 mg Pen

（3）名称の由来

海外に準じた

2. 一般名

（1）和名（命名法）

エボロクマブ（遺伝子組換え）（JAN）

（2）洋名（命名法）

Evolocumab（Genetical Recombination）（JAN）、evolocumab（r-INN）

（3）ステム

ヒト型モノクローナル抗体：-umab

3. 本質

エボロクマブは、ヒトプロタンパク質転換酵素サブチリシン／ケキシン 9 型（PCSK9）に対する遺伝子組換えヒト IgG2 モノクローナル抗体である。エボロクマブは、チャイニーズハムスター卵巣細胞により産生される。エボロクマブは、441 個のアミノ酸残基からなる H 鎖（γ2 鎖）2 本及び 215 個のアミノ酸残基からなる L 鎖（λ鎖）2 本で構成される糖タンパク質である。

4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{6242}H_{9684}N_{1668}O_{1996}S_{56}$（タンパク質部分、4 本鎖）

H 鎖 $C_{2140}H_{3313}N_{571}O_{664}S_{21}$

L 鎖 $C_{981}H_{1529}N_{263}O_{334}S_{7}$

分子量：約 144,000

5. 化学名（命名法）

（1）和名（命名法）　該当しない

（2）洋名（命名法）　該当しない

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

開発コード：AMG145

*：新薬承認情報提供時に「2.3.S 原薬」の項をまとめて示した

7. CAS 登録番号

1256937-27-5

Ⅱ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

無色～淡黄色の液で、半透明～白色の非晶質の微粒子を含むことがある。

(2) 溶解性

該当しない

(3) 吸湿性

該当しない

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当しない

(5) 酸塩基解離定数

該当しない

(6) 分配係数

該当しない

(7) その他の主な示性値

pH：4.7～5.3

2. 有効成分の各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存期間	結　果
長期保存試験	-30°C	24 ヵ月	規格に適合。
加速試験	5°C	6 ヵ月	規格に適合。高分子量分子種の増加傾向が認められた。
苛酷試験	40°C	1 ヵ月	高分子量分子種の増加及び塩基性ピークの増加が認められた。

3. 有効成分の確認試験法

(1) ELISA

(2) ペプチドマップ

4. 有効成分の定量法

紫外可視吸光度測定法

*：新薬承認情報提供時に「2.3.S 原薬」の項をまとめて示した

2.3.P　製剤

Ⅰ. 製剤に関する項目

1. 剤形

（1）剤形の区別、外観及び性状

レパーサ皮下注 140 mg シリンジ

区別：水性注射剤

規格：1 シリンジ 1 mL 当たり 140 mg のエボロクマブ（遺伝子組換え）を含む。

性状：無色～淡黄色の液で、半透明～白色の非晶質の微粒子を含むことがある。

レパーサ皮下注 140 mg ペン

区別：水性注射剤

規格：1 ペン 1 mL 当たり 140 mg のエボロクマブ（遺伝子組換え）を含む。

性状：無色～淡黄色の液で、半透明～白色の非晶質の微粒子を含むことがある。

（2）溶液及び溶解時のpH、浸透圧比、粘度、比重、安定なpH域等

レパーサ皮下注 140 mg シリンジ、レパーサ皮下注 140 mg ペン

pH：4.7～5.3

浸透圧比：1.0～1.2　（日局生理食塩液に対する比）

（3）注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

該当しない

2. 製剤の組成

（1）有効成分（活性成分）の含量

レパーサ皮下注 140 mg シリンジ

1 シリンジ中：エボロクマブ（遺伝子組換え）140 mg を含む。

レパーサ皮下注 140 mg ペン

1 ペン中：エボロクマブ（遺伝子組換え）140 mg を含む。

（2）添加物

レパーサ皮下注 140 mg シリンジ、レパーサ皮下注 140 mg ペン

1 シリンジ中：

L-プロリン	25 mg
氷酢酸	1.2 mg
ポリソルベート80	0.1 mg
水酸化ナトリム	適量
注射用水	適量

（3）電解質の濃度

該当資料なし

（4）添付溶解液の組成及び容量

該当しない

＊：新薬承認情報提供時に「2.3.P 製剤」の項をまとめて示した

（5）その他
該当しない

3. 注射剤の調製法
該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意
該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存期間	結果
長期保存試験	5°C	24 ヵ月	規格に適合。
加速試験	25°C	6 ヵ月	25°C では 3 ヵ月まで、30°C では 2 ヵ月まで規格に適合。高分子量分子種の増加傾向、塩基性ピークの増加傾向、及び主ピークの減少傾向が認められた。
	30°C	6 ヵ月	
苛酷試験	40°C	1 ヵ月	1 週間まで規格に適合。高分子量分子種の増加、塩基性ピークの増加傾向、及び主ピークの減少傾向が認められた。
光安定性試験	総照度 120 万 lux･hr 以上及び総近紫外放射エネルギー 200W･h/m^2 以上、5°C		非包装では、エボロクマブの減少と高分子量分子種の増加が認められた。市販包装では、性状、pH、純度、力価に変化は認められなかった。
	2,000 lux、25°C、14 日		非包装では、エボロクマブの減少と高分子量分子種の増加が認められた。市販包装では、性状、pH、純度、力価に変化は認められなかった。
温度サイクル試験	-30～25°C	3 サイクル	性状、pH、純度、力価に変化は認められなかった。

6. 溶解後の安定性
該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）
該当資料なし

8. 生物学的試験法
該当資料なし

9. 製剤中の有効成分の確認試験法
ELISA

10. 製剤中の有効成分の定量法
紫外可視吸光度測定法

11. 力価
該当しない

＊：新薬承認情報提供時に「2.3.P 製剤」の項をまとめて示した

12. 混入する可能性のある夾雑物

高分子量分子種、宿主細胞由来不純物等

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

レパーサ皮下注 140 mg シリンジ

針カバー（注射針キャップ）：天然ゴム

レパーサ皮下注 140 mg ペン

針カバー（ペン先端部キャップ）：天然ゴム

14. その他

該当資料なし

*：新薬承認情報提供時に「2.3.P 製剤」の項をまとめて示した