イスパロクト静注用 500/1000/1500/2000/3000
（ツロクトコグ アルファ ペゴル（遺伝子組換え））に関する資料

本資料に記載された情報に係る権利及び内容の責任はノボ ノルディスク ファーマ株式会社に帰属するものであり、当該情報を適正使用以外の営利目的に利用することはできません。

ノボ ノルディスク ファーマ株式会社

ツロクトコグ アルファ ペゴル（遺伝子組換え）

2.3. 品質に関する概括資料

ノボ ノルディスク ファーマ株式会社

2.3.S　原薬

名称

INN	turoctocog alfa pegol
JAN（日本語）	ツロクトコグ アルファ ペゴル（遺伝子組換え）
JAN（英語）	Turoctocog Alfa Pegol (Genetical Recombination)

本質

ツロクトコグ アルファ ペゴルは、修飾糖タンパク質（分子量：約 216,000）であり、ツロクトコグアルファ（遺伝子組換え）の Ser750 に付加している糖鎖の非還元末端に 2 本のポリエチレングリコール鎖（合計の平均分子量：約 40,000）がアミノ基に結合したノイラミン酸が結合している。

構造

PEG 化部位：

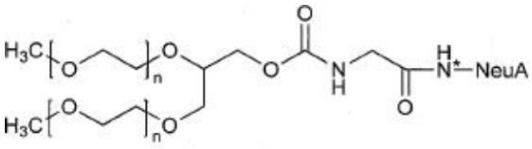
H 鎖 S750

主な糖鎖の推定構造：

H 鎖 S750

PEG-NeuA-Gal-GalNAc

ポリエチレングリコールの結合様式：



*NeuA のアミノ基

分子式：$C_{7480}H_{11381}N_{1999}O_{2177}S_{62}$（タンパク質部分、2 本鎖）

H 鎖　　$C_{3927}H_{5981}N_{1043}O_{1151}S_{29}$

L 鎖　　$C_{3553}H_{5400}N_{956}O_{1026}S_{33}$

分子量：約 216,000

安定性

	保存条件	実施期間	結果
長期保存試験	－80±10℃	36箇月	変化は認められなかった

注：「2.3.S 原薬」の項をまとめて示し、新薬承認情報提供時に置き換えた。

2.3.P　製剤

組成・性状

本剤は薬剤バイアルと添付溶解液シリンジ（プレフィルドシリンジ｢日本薬局方 生理食塩液｣ 4mL）からなる。

製 剤（1 バイアル中）		イスパロクト静注用				
		500	1000	1500	2000	3000
有効成分	ツロクトコグ アルファ ペゴル（遺伝子組換え）	500 国際単位	1000 国際単位	1500 国際単位	2000 国際単位	3000 国際単位
添加剤	塩化ナトリウム	36 mg				
	L-ヒスチジン	6 mg				
	精製白糖	12 mg				
	ポリソルベート 80	0.4 mg				
	L-メチオニン	0.22 mg				
	塩化カルシウム 二水和物	1.0 mg				
	水酸化ナトリウム	適量				
	塩酸	適量				
添付溶解液シリンジ（1 シリンジ中）		日本薬局方 生理食塩液 4 mL				
溶解後の有効成分濃度（IU/mL）		125	250	375	500	750

本剤はチャイニーズハムスター卵巣細胞を用いた遺伝子組換え技術により製造する。また、製造工程においてチャイニーズハムスター卵巣細胞由来のモノクローナル抗体及びチャイニーズハムスター卵巣細胞由来の酵素を使用している。

性状・剤形	本剤は凍結乾燥した白色の粉末である。本剤は、用時溶解して用いる注射剤である。
pH	6.9
浸透圧比[注)]	約 2（生理食塩液に対する比）

注）生理食塩液の浸透圧を 286mOsm として算出

安定性

	保存条件	実施期間	保存形態	結果
長期保存試験	5±3℃	30箇月	クロロブチルゴム栓及びガラスバイアル	変化は認められなかった
加速試験	30±2℃、75±5% RH	12箇月		変化が認められたが規格に適合した
	40±2℃、75±5% RH	6箇月		変化が認められた
溶解後安定性試験[a)]	5±3℃	溶解して48時間		安定であった
	30±2℃	溶解して24時間		
光安定性試験	25℃以下	総照度：120万lux·h以上 総近紫外放射エネルギー：250 W・h/m^2	クロロブチルゴム栓及びガラスバイアル（紙箱有又は無）	光に不安定であった

a) 5±3℃で 4～19 箇月保存後の製剤、又は 5±3℃で 18～19 箇月保存後に 30±2℃で 12 箇月保存した製剤で試験

注：「2.3.P 製剤」の項をまとめて示し、新薬承認情報提供時に置き換えた。