

TABLE OF CONTENTS

2.3.S	原薬.....	2
1	一般情報.....	2
1.1	名称.....	2
1.1.1	国際一般名 (INN)	2
1.1.2	一般的名称 (JAN)	2
1.1.3	慣用名、別名、略号、記号番号.....	2
1.2	分子式及び分子量.....	2
2	有効成分の各種条件下における安定性.....	2
2.3.P	製剤.....	3
1	組成、性状.....	3
2	製剤の各種条件下における安定性.....	3
3	注射用水による希釈後の安定性.....	3

2.3.S 原薬 注)

1 一般情報

1.1 名称

1.1.1 国際一般名 (INN)

andexanet alfa

1.1.2 一般的名称 (JAN)

一般的名称

(日本名) アンデキサネット アルファ (遺伝子組換え)

(英名) Andexanet Alfa (Genetical Recombination)

化学名又は本質

(日本名)

アンデキサネット アルファは、遺伝子組換えヒト活性型血液凝固第 X 因子 (FXa) 類縁体であり、L 鎖は、FXa の L 鎖の 1~5 番目及び 40~139 番目のアミノ酸に相当し、H 鎖の 185 番目のアミノ酸残基は Ala に置換されている。アンデキサネット アルファはチャイニーズハムスター卵巣細胞により産生される。アンデキサネット アルファは 105 個のアミノ酸残基からなる L 鎖及び 254 個のアミノ酸残基からなる H 鎖で構成される糖タンパク質 (分子量: 約 41,000) である。

(英名)

Andexanet Alfa is a recombinant activated human blood coagulation factor X (FXa) analog whose L-chain corresponds to amino acids at positions 1 – 5 and 40 – 139 of L-chain of FXa, and whose amino acid residue at position 185 of H-chain is substituted by Ala. Andexanet Alfa is produced in Chinese hamster ovary cells. Andexanet Alfa is a glycoprotein (molecular weight; ca. 41,000) composed of an L-chain consisting of 105 amino acid residues and an H-chain consisting of 254 amino acid residues.

1.1.3 慣用名、別名、略号、記号番号

開発番号: BMS-986244、ALXN2070

CAS 登録番号: 1262449-58-0

1.2 分子式及び分子量

C₁₇₅₀H₂₇₀₇N₄₈₉O₅₄₀S₂₇: 40,101.93 (タンパク質部分, 2 本鎖)

H 鎖 C₁₂₆₀H₁₉₇₁N₃₅₁O₃₇₅S₁₄: 28,485.17

L 鎖 C₄₉₀H₇₃₈N₁₃₈O₁₆₅S₁₃: 11,618.77

2 有効成分の各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	-60℃以下/遮光	10000L PETG 製ボトル	48 ヶ月間 (60 ヶ月まで実施)	48 ヶ月まで安定であった
加速試験	2~8℃	10000L PETG 製ボトル	3 ヶ月間	1 ヶ月まで安定であった

2.3.P 製剤
オンデキサ静注用 200g

2.3.P 製剤 注)

1 組成、性状

本品は白色～微黄白色の塊又は粉末で、単回使用の無菌凍結乾燥製剤である。

成分	規格	配合目的	充填量 (mg/vial)
アンデキサネット アルファ (遺伝子組換え)	別紙規格	有効成分	207
トロメタモール	局外規	緩衝剤	6.7
トロメタモール塩酸塩	別紙規格	緩衝剤	7.6
L-アルギニン塩酸塩	日局	安定剤	98
精製白糖	日局	安定剤	207
D-マンニトール	日局	賦形剤	518
ポリソルベート 80	日局	安定剤	2.1

2 製剤の各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存形態/光照射量	保存期間	結果	
長期保存試験	2～8℃/遮光	36 ヶ月 (60 ヶ月まで実施)	20mL ガラスバイアル 正置	36 ヶ月まで安定であり、規格の範囲内であった。	
加速試験	25±2℃/60±5%RH /遮光	6 ヶ月		6 ヶ月まで安定であり、規格の範囲内であった。	
苛酷試験	温度	40±2℃/75±5%RH /遮光		3 ヶ月	3 ヶ月まで安定であり、規格の範囲内であった。
	光	25±2℃/60±5%RH 曝光、二次包装による遮光		総照度 120 万 lx・h 以上、総近紫外放射エネルギー 200W・h/m ² 以上照射	曝光した試料において高分子種及び不溶性微粒子の増加を認めたが、いずれも判定基準に適合した。

測定項目：含量、外観変化、pH など

3 注射用水による希釈後の安定性

アンデキサネット アルファ (遺伝子組換え) 濃度	希釈液	保存形態	保存条件及び期間	結果
10mg/mL	注射用水	タイプ 1 ガラスバイアル	保存条件：2～8℃ 期間：16 時間	変化なし
		ポリオレフィン製バッグ	保存条件：室温	
		ポリ塩化ビニル製バッグ	期間：8 時間	

注) 2.3品質に関する概括資料を新薬承認情報提供時に本項と置き換えた。