2.3 品質に関する概括資料

2.3.S 原薬 [1]

1. 一般名

和名
エプコリタマブ（遺伝子組換え）（JAN）

洋名
Epcoritamab (Genetical Recombination)（JAN）

2. 分子式及び分子量

（1） 分子式
$C_{6471}H_{9973}N_{1735}O_{2010}S_{44}$（タンパク質部分、4 本鎖）

分子量
約 149,000

3. 本質

エプコリタマブは、CD3ε 鎖及び CD20 に対する遺伝子組換え二重特異性モノクローナル抗体であり、抗 CD3ε 鎖抗体の可変部はマウス抗体に、その他はヒト IgG1 に由来し，抗 CD20 抗体はヒト IgG1 に由来する。抗 CD3ε-H 鎖の 4 つのアミノ酸残基が置換（L242F、L243E、D273A、F413L）され，C 末端の K455 は除去されている。また、抗 CD20-H 鎖の 4 つのアミノ酸残基が置換（L239F、L240E、D270A、K414R）され、C 末端の K452 は除去されている。エプコリタマブは、CHO 細胞により産生される。エプコリタマブは、454 個のアミノ酸残基からなる抗 CD3ε-H 鎖（μ1 鎖）1 本、215 個のアミノ酸残基からなる抗 CD3ε-L 鎖（λ 鎖）1 本、451 個のアミノ酸残基からなる抗 CD20-H 鎖（γ1 鎖）1 本及び 215 個のアミノ酸残基からなる抗 CD20-L 鎖（κ 鎖）1 本で構成される糖タンパク質（分子量約 149,000）である。

4. 一般特性

（1） 性状
無色～淡黄色の澄明または僅かに乳白色を呈する液

（2） pH
5.2～5.8

[1] 「2.3.S 原薬」の項を新薬情報提供時に置き換えた。

5. 安定性

原薬の安定性は下表のとおりである。

試験	保存条件	保存形態	結果
長期保存試験	−70°C	プラスチックバッグ	実施期間を通じて品質特性に明確な変化は認められなかった。
加速試験	5°C		高分子量体の増加傾向が認められた。
苛酷試験	25°C/60%RH		分解傾向が認められた。
	40°C/75%RH		分解傾向が認められた。

測定項目：性状、pH、純度試験、定量法等

2.3.P 製剤 [2]

1. 組成・性状

販売名	エプキンリ皮下注 4 mg、エプキンリ皮下注 48 mg
剤形・含量	1 バイアル（0.8 mL）中にエプコリタマブ（遺伝子組換え）を 4.0 mg 又は 48.0 mg 含有する注射剤
性状	淡黄色の澄明または僅かに乳白色を呈する液
pH	5.2～5.8
添加剤	酢酸ナトリウム水和物、氷酢酸、D-ソルビトール、ポリソルベート 80、注射用水
容器	ガラスバイアル及びゴム栓

2. 安定性

試験	製剤規格	保存条件	保存形態	結果
長期保存試験	4 mg	5°C	ガラスバイアル及びゴム栓	高分子量体の増加傾向が認められたが、それ以外の試験項目については、実施期間を通じて品質特性に明確な変化は認められなかった。
	48 mg			
加速試験	4 mg	25°C/60%RH		分解傾向が認められた。
	48 mg			
苛酷試験	4 mg	40°C/75%RH		分解傾向が認められた。
	48 mg			
光安定性	4 mg	ICH*		分解傾向が認められた。
	48 mg			

*：総照度 120 万 lux･h 以上及び総近紫外放射エネルギー200 W･h/m^2 以上
測定項目：性状、pH、純度試験、生物活性、定量等

[2] 「2.3.P 製剤」の項を新薬情報提供時に置き換えた。