2.3 品質に関する概括資料の目次

2.3.S 原薬..... 2
2.3.P 製剤..... 4

2.3.S 原薬*

INN： Aflibercept

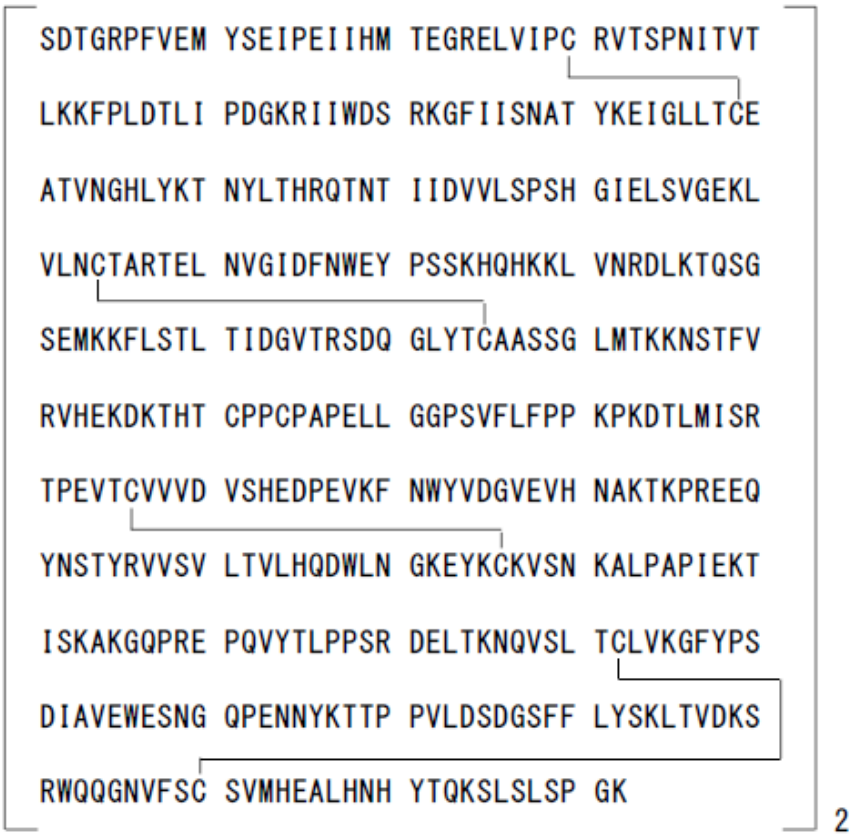
JAN： アフリベルセプト（遺伝子組換え）

化学名又は本質記載： 本品の本質は、遺伝子組換え融合糖たん白質であり、1～102 番目はヒト血管内皮増殖因子受容体 1 の第 2 Ig ドメイン、105～205 番目はヒト血管内皮増殖因子受容体 2 の第 3 Ig ドメイン、また 220～432 番目はヒト IgG1 の Fc ドメインからなる。本品は、チャイニーズハムスター卵巣細胞により産生される。本品は、432 アミノ酸残基からなるサブユニット 2 分子から構成される糖たん白質（分子量：約 115000）である。

CAS 登録番号： 862111-32-8

構造：

アミノ酸配列及びジスルフィド結合：

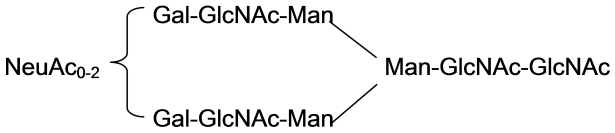


N36, N68, N123, N196, N282：糖鎖結合；K432：部分的プロセシング
C211-C211, C214-C214：サブユニット間ジスルフィド結合

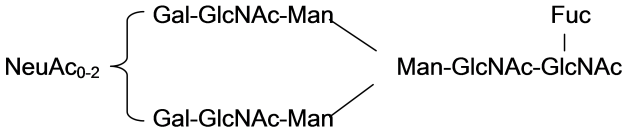
＊ 新薬承認情報提供時に置き換え

糖鎖構造：

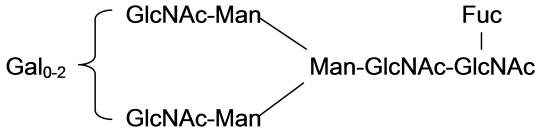
N123, N196:



N36, N68:



N282:



分子式・分子量： $C_{4330}H_{6812}N_{1168}O_{1306}S_{32}$：97153.54（たん白質部分、2 量体）
$C_{2165}H_{3408}N_{584}O_{653}S_{16}$：48578.79（たん白質部分、単量体）
糖たん白質として：約 115000

2.3.P 製剤*

組成・性状：

販売名	アイリーア 8mg 硝子体内注射液 114.3mg/mL
有効成分	1 回の投与量（0.07mL）中 アフリベルセプト（遺伝子組換え） 8mg
	1 バイアル（0.263mL）中 アフリベルセプト（遺伝子組換え） 30.1mg
添加剤	1 バイアル中 L－アルギニン塩酸塩：2.77mg L－ヒスチジン：0.149mg L－ヒスチジン塩酸塩水和物：0.350mg 精製白糖：13.2mg ポリソルベート 20：0.079mg
性状	無色～微黄色の澄明又はわずかに混濁した液

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		2～8℃	ガラス製バイアル	18 ヵ月	規格内
加速試験		25℃		6 ヵ月	1 ヵ月まで規格内（純度低下）
苛酷試験	光	白色蛍光ランプ 紫外照射ランプ		総照度 120 万 lx･hr、総近紫外放射エネルギー200W･h/m^2	規格外（純度低下）

＊ 新薬承認情報提供時に置き換え