2.3　品質に関する概括資料

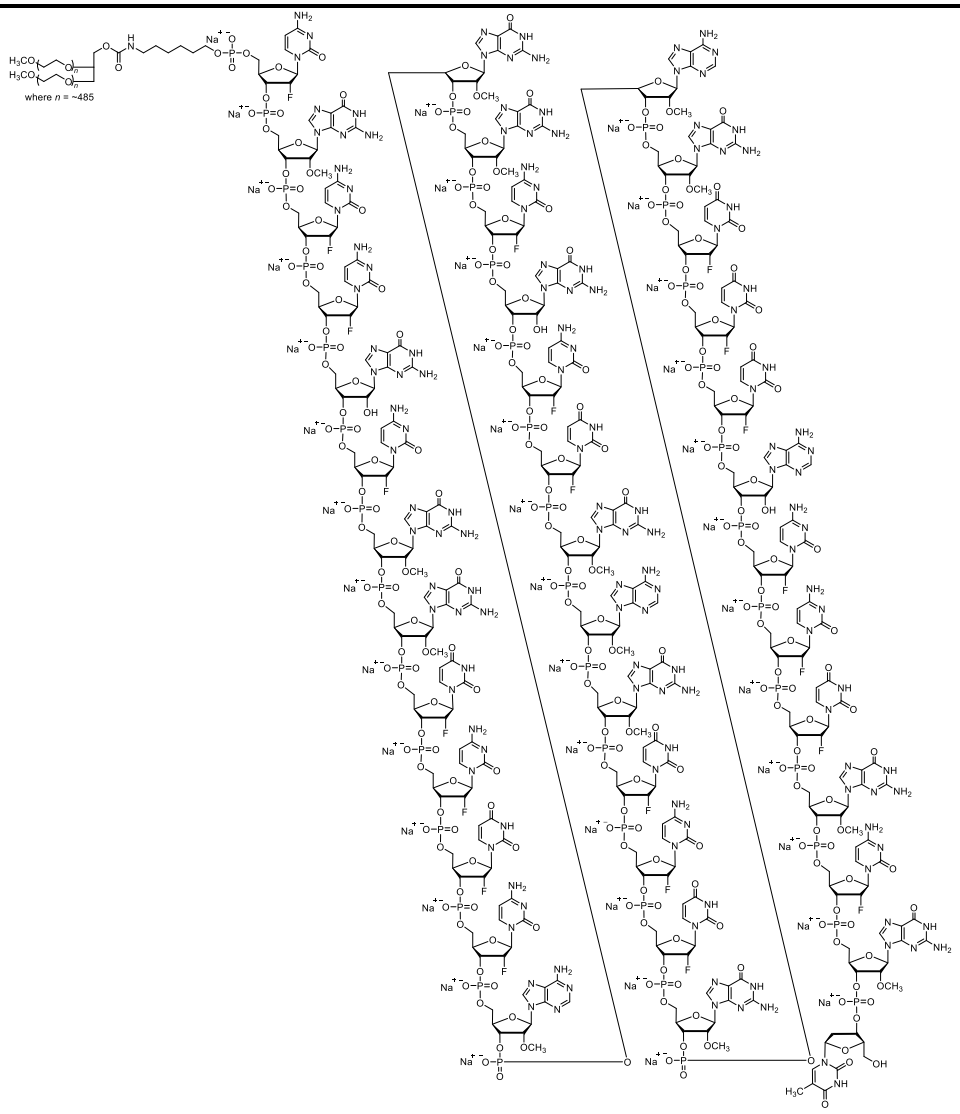
申請医薬品の販売名，剤形等は以下の通りである。

販売名	アイザベイ硝子体内注射液 20 mg/mL
原薬の一般名	アバシンカプタド　ペゴルナトリウム
企業名	アステラス製薬株式会社
剤形	水性注射剤
成分・含量 （1 バイアル中）	アバシンカプタド ペゴルナトリウム（リンカーを含むオリゴヌクレオチド部分として）7.0 mg

2.3.S　原薬*

1.　名称に関する項目

一般名	（日本名）アバシンカプタド　ペゴルナトリウム
	（英　名）Avacincaptad Pegol Sodium
化学名	Nonatriaconta sodium salt of 5'-O-[({6-[({(2RS)-2,3-bis[ω-methoxypoly(oxyethylene)]propoxy}carbonyl)amino]hexyl}oxy)(hydroxy)phosphoryl]-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-guanylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'- fluorouridylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorouridylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-O-methyladenylyl-(3'→5')-2'-O- methylguanylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-guanylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorouridylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→5')-2'-O-methyladenylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorouridylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorouridylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→5')-2'-O-methyladenylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorouridylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorouridylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorouridylyl-(3'→5')-adenylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorouridylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→5')-2'-deoxy-2'-fluorocytidylyl-(3'→5')-2'-O-methylguanylyl-(3'→3')-thymidine
分子量	非 PEG 化 avacincaptad pegol (遊離酸): 12,882 Da average mass Avacincaptad pegol (遊離酸): 12,882 Da + 約 43,000 Da PEG = 約 55,882 Da
分子式	非 PEG 化 avacincaptad pegol (遊離酸): $C_{389}H_{482}F_{21}N_{142}O_{258}P_{39}$ Avacincaptad pegol (遊離酸): $C_{395}H_{492}F_{21}N_{142}O_{262}P_{39}(C_2H_4O)_{2n}$ ただし，n=約 485 本品の PEG 鎖は 2 分岐型であり，それぞれの重合度が約 485，合わせて約 970 となる。

構造式	
CAS 登録番号	1491144-00-3

2.　物理化学的性質

項目	結果
性状	白色～微黄色の固体
溶解性	水　500 mg/mL 以上（溶けやすい） 10 mM リン酸緩衝生理食塩水，pH 7.3　500 mg/mL 以上（溶けやすい） アセトニトリル　75 mg/mL 以上（やや溶けやすい）
融解温度（Tm）	加熱：81.7°C，冷却：80.8°C（希釈液：0.45%生理食塩水）
酸解離定数（p*K*a）	6.9～7.9
吸湿性	あり
pH	6.5～8.5（本品の 1% w/v 水溶液）

3.　安定性

試験の種類	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	-20ºC	60 箇月	高密度ポリエチレンボトル	規格内
加速試験	5ºC	6 箇月		規格内

4.　確認試験法

液体クロマトグラフィー

5.　定量法

(1)　紫外可視吸光度測定法

(2)　原子吸光光度法

2.3.P　製剤*

1.　組成・性状

販売名	アイザベイ硝子体内注射液 20 mg/mL
有効成分の含量（1 バイアル中）	アバシンカプタド ペゴルナトリウム（リンカーを含むオリゴヌクレオチド部分として）7.0 mg
添加剤（1 バイアル中）	リン酸水素二ナトリウム七水和物 0.693 mg リン酸二水素ナトリウム一水和物 0.0896 mg 塩化ナトリウム 2.91 mg
性状	無色～微黄色の澄明の液
pH	6.8～7.8

2.　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	5ºC	ガラスバイアル	36 箇月	規格内
加速試験	25ºC/60%RH	ガラスバイアル	6 箇月	純度が低下した
苛酷試験（光）	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	二次包装なしのガラスバイアル	－	規格内

3.　製剤中の有効成分の確認試験法

液体クロマトグラフィー

4.　製剤中の有効成分の定量法

紫外可視吸光度測定法

*　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。