

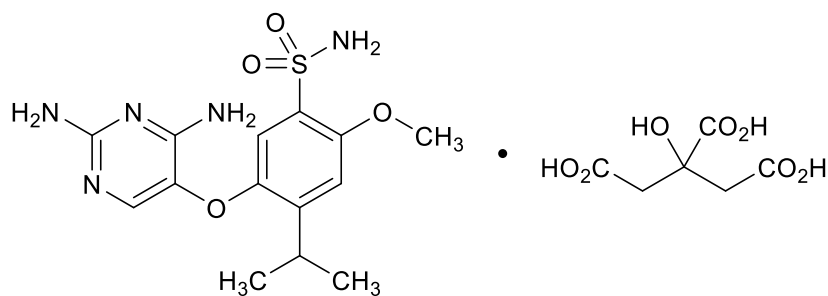
(別表 2) INN に記載された品目の我が国における医薬品一般的名称

(平成 18 年 3 月 31 日薬食審査発第 0331001 号厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知に示す別表 2)

登録番号 301-5-B1

JAN (日本名) : ゲーファピキサントクエン酸塩

JAN (英名) : Gefapixant Citrate



$C_{14}H_{19}N_5O_4S \cdot C_6H_8O_7$

5-[(2,4-ジアミノピリミジン-5-イル)オキシ]-2-メトキシ-4-(プロパン-2-イル)ベンゼン-1-スルホン  
アミド ークエン酸塩

5-[(2,4-Diaminopyrimidin-5-yl)oxy]-2-methoxy-4-(propan-2-yl)benzene-1-sulfonamide monocitrate

登録番号 301-5-B3

JAN (日本名) : ファリシマブ (遺伝子組換え)

JAN (英名) : Faricimab (Genetical Recombination)

アミノ酸配列及びジスルフィド結合

抗 VEGF-A-L 鎖

DIQLTQSPSS	LSASVGDRVT	ITCSASQDIS	NYLNWYQQKP	GKAPKVLIIYF
TSSLHSGVPS	RFSGSGSGTD	FTLTISSLQP	EDFATYYCQQ	YSTVPWTFGQ
GTKVEIKRTV	AAPSVFIFPP	SDEQLKSGTA	SVVCLLNNFY	PREAKVQWKV
DNALQSGNSQ	ESVTEQDSKD	STYLSLSTLT	LSKADYEKHK	VYACEVTHQG
LSSPVTKSFN	RGEC			

抗 Ang2-L 鎖

SYVLTQPPSV	SVAPGQTARI	TCGGNNIGSK	SVHWYQQKPG	QAPVLVVYDD
SDRPSGIPER	FSGSNSGNTA	TLTISRVEAG	DEADYYCQVW	DSSSDHWVFG
GGTKLTVLSS	ASTKGPSVFP	LAPSSKSTSG	GTAALGCLVK	DYFPEPVTVS
WNSGALTSGV	HTFPAVLQSS	GLYSLSSVVT	VPSSSLGTQT	YICNVNHKPS
NTKVDKKVEP	KSC			

抗 VEGF-A-H 鎖

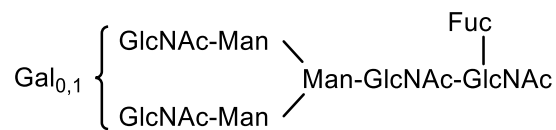
EVQLVESGGG	LVQPGGSLRL	SCAASGYDFT	HYGMNWVRQA	PGKGLEWVWG
INTYTGPTY	AADFKRRFTF	SLDTSKSTAY	LQMNSLRAED	TAVYYCAKYP
YYYGTSHWYF	DVWGQGTLLV	VSSASTKGPS	VFPLAPSSKS	TSGGTAALGC
LVKDYFPEPV	TVSWNSGALT	SGVHTFPAVL	QSSGLYSLSS	VVTVPSSSLG
TQTYICNVNH	KPSNTKVDKK	VEPKSCDKTH	TCPPCPAPEA	AGGPSVFLFP
PKPKDTLMAS	RTPEVTCVVV	DVSHEDPEVK	FNWYVDGVEV	HNAKTKPREE
QYNSTYRVVS	VLTVLAQDWL	NGKEYKCKVS	NKALGAPIEK	TISKAKGQPR
EPQVYTLPPC	RDELTKNQVS	LWCLVKGFYP	SDIAVEWESN	GQPENNYKTT
PPVLDSDGSF	FLYSKLTVDK	SRWQQGNVFS	CSVMHEALHN	AYTQKSLSL
PGK				

抗 Ang2-H 鎖

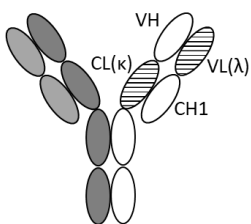
QVQLVQSGAE	VKKPGASVKV	SCKASGYTFT	GYMHWVRQA	PGQGLEWMGW
INPNSGGTNY	AQKFQGRVTM	TRDTSISTAY	MELSRLRSDD	TAVYYCARSP
NPYYVDSSGY	YYPGAFDIWG	QGTMTVSSA	SVAAPSVFIF	PPSDEQLKSG
TASVVCLLNN	FYPREAKVQW	KVDNALQSGN	SQESVTEQDS	KDSTYSLSST
LTLSKADYEK	HKVYACEVTH	QGLSSPVTKS	FNRGECDKTH	TCPPCPAPEA
AGGPSVFLFP	PKPKDTLMAS	RTPEVTCVVV	DVSHEDPEVK	FNWYVDGVEV
HNAKTKPREE	QYNSTYRVVS	VLTVLAQDWL	NGKEYKCKVS	NKALGAPIEK
TISKAKGQPR	EPQVCTLPPS	RDELTKNQVS	LSCAVKGFYP	SDIAVEWESN
GQPENNYKTT	PPVLDSGSE	FLVSKLTVDK	SRWQQGNVFS	CSVMHEALHN
AYTQKSLSL	PGK			

抗 Ang2-H 鎖 Q1 : 部分的ピログルタミン酸 ; 抗 VEGF-A-H 鎖 N303, 抗 Ang2-H 鎖 N313 : 糖鎖結合 ;  
 抗 VEGF-A-H 鎖 K453, 抗 Ang2-H 鎖 K463 : 部分的プロセシング  
 抗 VEGF-A-L 鎖 C214 – 抗 VEGF-A-H 鎖 C226, 抗 Ang2-L 鎖 C213 – 抗 Ang2-H 鎖 C236,  
 抗 VEGF-A-H 鎖 C232 – 抗 Ang2-H 鎖 C242, 抗 VEGF-A-H 鎖 C235 – 抗 Ang2-H 鎖 C245,  
 抗 VEGF-A-H 鎖 C360 – 抗 Ang2-H 鎖 C365 : ジスルフィド結合

主な糖鎖の推定構造



模式図



C<sub>6506</sub>H<sub>9962</sub>N<sub>1724</sub>O<sub>2041</sub>S<sub>45</sub> (タンパク質部分, 4本鎖)

抗 VEGF-A-H 鎖 C<sub>2230</sub>H<sub>3393</sub>N<sub>581</sub>O<sub>677</sub>S<sub>16</sub>

抗 Ang2-H 鎖 C<sub>2262</sub>H<sub>3468</sub>N<sub>606</sub>O<sub>707</sub>S<sub>19</sub>

抗 VEGF-A-L 鎖 C<sub>1035</sub>H<sub>1593</sub>N<sub>273</sub>O<sub>338</sub>S<sub>5</sub>

抗 Ang2-L 鎖 C<sub>979</sub>H<sub>1518</sub>N<sub>264</sub>O<sub>319</sub>S<sub>5</sub>

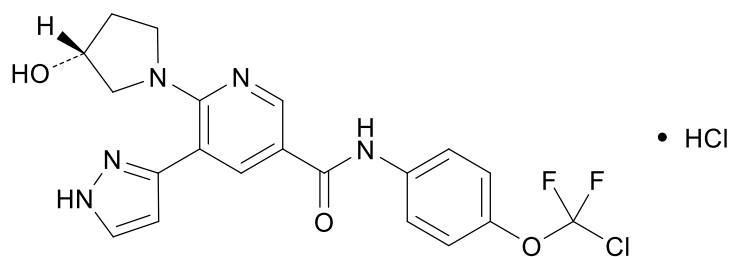
ファリシマブは、遺伝子組換えヒト化二重特異性モノクローナル抗体であり、マウス抗ヒト血管内皮増殖因子 A (VEGF-A) 抗体及びヒト抗ヒトアンジオポエチン 2 (Ang2) 抗体の相補性決定部、ヒトフレームワーク部並びに抗 Ang2-L 鎖の CL ドメインと H 鎖の CH1 ドメインが交換されたヒト IgG1 の定常部からなる。抗 VEGF-A-H 鎖の 240, 241, 259, 316, 335, 360, 372 及び 441 番目のアミノ酸残基はそれぞれ Ala, Ala, Ala, Ala, Gly, Cys, Trp 及び Ala に置換されている。抗 Ang2-H 鎖の 250, 251, 269, 326, 345, 365, 382, 384, 423 及び 451 番目のアミノ酸残基はそれぞれ Ala, Ala, Ala, Ala, Gly, Cys, Ser, Ala, Val 及び Ala に置換されている。ファリシマブは、チャイニーズハムスター卵巣細胞により産生される。ファリシマブは、453 個のアミノ酸残基からなる抗 VEGF-A-H 鎖 ( $\gamma$ 1 鎖) 1 本、214 個のアミノ酸残基からなる抗 VEGF-A-L 鎖 ( $\kappa$  鎖) 1 本、463 個のアミノ酸残基からなる抗 Ang2-H 鎖 ( $\gamma$ 1- $\kappa$  鎖) 1 本及び 213 個のアミノ酸残基からなる抗 Ang2-L 鎖 ( $\lambda$ - $\gamma$  鎖) 1 本で構成される糖タンパク質 (分子量約 149,000) である。

Faricimab is a recombinant bispecific humanized monoclonal antibody composed of complementarity-determining regions derived from mouse anti-human vascular endothelial growth factor A (VEGF-A) antibody and human anti-human angiopoietin 2 (Ang2), framework regions and human IgG1 constant regions in which the anti-Ang2, CL domain in L-chain and CH1 domain in H-chain are exchanged each other. In the anti-VEGF-A-H-chain, the amino acid residues at position 240, 241, 259, 316, 335, 360, 372 and 441 are substituted by Ala, Ala, Ala, Ala, Gly, Cys, Trp and Ala, respectively. In the anti-Ang2-H-chain, the amino acid residues at position 250, 251, 269, 326, 345, 365, 382, 384, 423 and 451 are substituted by Ala, Ala, Ala, Ala, Gly, Cys, Ser, Ala, Val and Ala, respectively. Faricimab is produced in Chinese hamster ovary cells. Faricimab is a glycoprotein (molecular weight: ca. 149,000) composed of an anti-VEGF-A-H-chain ( $\gamma$ 1-chain) consisting of 453 amino acid residues, an anti-VEGF-A-L-chain ( $\kappa$ -chain) consisting of 214 amino acid residues, an anti-Ang2-H-chain ( $\gamma$ 1- $\kappa$ -chain) consisting of 463 amino acid residues and an anti-Ang2-L-chain ( $\lambda$ - $\gamma$ -chain) consisting of 213 amino acid residues each.

登録番号 301-5-B5

JAN (日本名) : アシミニブ塩酸塩

JAN (英名) : Asciminib Hydrochloride



$C_{20}H_{18}ClF_2N_5O_3 \cdot HCl$

*N*-[4-(クロロジフルオロメトキシ)フェニル]-6-[(3*R*)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル]-5-(1*H*-ピラゾール-3-イル)ピリジン-3-カルボキシアミド 一塩酸塩

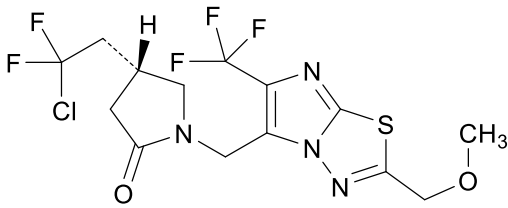
*N*-[4-(Chlorodifluoromethoxy)phenyl]-6-[(3*R*)-3-hydroxypyrrolidin-1-yl]-5-(1*H*-pyrazol-3-yl)pyridine-3-carboxamide monohydrochloride



登録番号 301-5-B7

JAN (日本名) : パドセボニル

JAN (英名) : Padsevonil



$C_{14}H_{14}ClF_5N_4O_2S$

(4*R*)-4-(2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル)-1-{{2-(メトキシメチル)-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[2,1-*b*][1,3,4]チアジアゾール-5-イル}メチル}ピロリジン-2-オン

(4*R*)-4-(2-Chloro-2,2-difluoroethyl)-1-{{2-(methoxymethyl)-6-(trifluoromethyl)imidazo[2,1-*b*][1,3,4]thiadiazol-5-yl}methyl}pyrrolidin-2-one

登録番号 301-5-B8

JAN (日本名) : コンシズマブ (遺伝子組換え)

JAN (英名) : Concizumab (Genetical Recombination)

アミノ酸配列及びジスルフィド結合

### L鎖

DIVMTQTPLS LSVTPGQPAS ISCKSSQSLL ESDGKTYLNW YLQKPGQSPQ  
LLIYLVSILD SGVPDRFSGS GSGTDFTLKI SRVEAEDVGV YYCLQATHFP  
QTFGGGKVE IKRTVAAPSV FIFPPSDEQL KSGTASVVCL LNNFYBREAK  
VQWKVDNALQ SGNSQESVTE QDSKDYSTYSL SSTLTLSKAD YEKHKVYACE  
VTHQGLSSPV TKSFNREGC

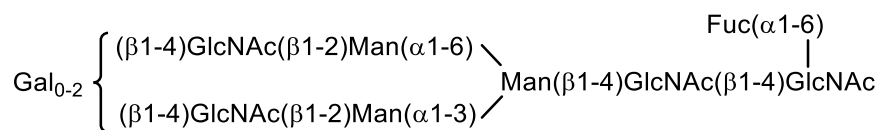
### H鎖

EVQLVESGGG LVKPGGSLRL SCAASGFTFS NYAMSWVRQT PEKRLEWVAT  
ISRSGSYSYF PDSVQGRFTI SRDNAKNSLY LQMNSLRAED TAVYYCARLG  
GYDEGDAMDS WGQGTITVTVS SASTKGPSVF PLAPCSRSTS ESTAALGCLV  
KDYFPEPPTV SWNSGALTSG VHTFPAVLQS SGLYSLSSVY TVPSSSLGK  
TYTCNVDPKPKD  
SNTKVDKRVK SKYGPPCPPC PAPEFLGGPS VFLFPPKPKD  
TLMISRTPEV TCVVVDVDSQE DPEVQFNWYV DGVEVHNAKT KPREEQFNST  
YRVVSVLTVL HQDWLNGKEY KCKVSNKGLP SSIIEKTISKA KGQPREPQVY  
TLPPSQEEMT KNQVSLTCLV KGFYPSDIAV EWESNGQPEN NYKTTTPVLD  
SDGSFFFLYSR LTVDKSRWQE GNVFSCSVMH EALHNHYTQK SLSLSLGK

H鎖 N298 : 糖鎖結合 ; H鎖 K448 : 部分的プロセッシング

L鎖 C219 – H鎖 C135, H鎖 C227 – H鎖 C227, H鎖 C230 – H鎖 C230 : ジスルフィド結合

主な糖鎖の推定構造



C<sub>6462</sub>H<sub>10004</sub>N<sub>1712</sub>O<sub>2046</sub>S<sub>46</sub> (タンパク質部分, 4本鎖)

H鎖 C<sub>2178</sub>H<sub>3360</sub>N<sub>580</sub>O<sub>682</sub>S<sub>17</sub>

L鎖 C<sub>1053</sub>H<sub>1646</sub>N<sub>276</sub>O<sub>341</sub>S<sub>6</sub>

コンシズマブは、遺伝子組換えヒト化モノクローナル抗体であり、マウス抗ヒト組織因子経路インヒビター (TFPI) の相補性決定部、ヒトフレームワーク部及びヒト IgG4 の定常部からなり、H鎖 229 番目のアミノ酸残基が Pro に置換されている。コンシズマブは、チャイニーズハムスター卵巣細胞により産生される。コンシズマブは、448 個のアミノ酸残基からなる H鎖 (γ4 鎖) 2 本及び 219 個のアミノ酸残基からなる L鎖 (κ 鎖) 2 本で構成される糖タンパク質 (分子量 : 約 149,000) である。



Concizumab is a recombinant humanized monoclonal antibody composed of complementarity-determining regions derived from mouse anti-human tissue factor pathway inhibitor (TFPI) monoclonal antibody, human framework regions and human IgG4 constant regions, whose amino acid residue at position 229 in the H-chain is substituted by Pro. Concizumab is produced in Chinese hamster ovary cells. Concizumab is a glycoprotein (molecular weight: ca. 149,000) composed of 2 H-chains ( $\gamma$ 4-chains) consisting of 448 amino acid residues each and 2 L-chains ( $\kappa$ -chains) consisting of 219 amino acid residues each.

※ JAN 以外の情報は、参考として掲載しました。

平成 30 年 7 月 3 日薬生薬審発 0703 第 4 号厚生労働省医薬・生活衛生局医薬品審査管理課長通知の別添

正	誤
<p>(別表 2)</p> <p>登録番号 29-4-B14</p> <p>JAN (日本名) : ネモリズマブ (遺伝子組換え)</p> <p>JAN (英名) : Nemolizumab (Genetical Recombination)</p> <p>(略)</p> <p>ネモリズマブは、遺伝子組換えヒト化モノクローナル抗体であり、マウス抗ヒトインターロイキン-31 受容体モノクローナル抗体の相補性決定部、ヒトフレームワーク部及びヒト IgG2 の定常部からなる。H 鎖の <u>135, 137, 141, 142, 223, 268, 355</u> と <u>419</u> 番目のアミノ酸残基はそれぞれ Ser, Lys, Gly, Gly, Ser, Gln, Gln と Glu に置換されており、C 末端の Gly と Lys は除去されている。ネモリズマブは、チャイニーズハムスター卵巣細胞により産生される。ネモリズマブは、445 個のアミノ酸残基からなる H 鎖 (γ2 鎖) 2 本及び 214 個のアミノ酸残基からなる L 鎖 (κ 鎖) 2 本で構成される糖タンパク質 (分子量 : 約 147,000) である。</p> <p>Nemolizumab is a recombinant humanized monoclonal antibody composed of complementarity-determining regions derived from mouse anti-human interleukin-31 receptor antibody, human framework regions and human IgG2 constant regions. In the H-chain, amino acid residues at position <u>135, 137, 141, 142, 223, 268, 355</u> and <u>419</u> are substituted by Ser, Lys, Gly, Gly, Ser, Gln, Gln and Glu, respectively, and Gly and Lys at the C-terminus are deleted. Nemolizumab is produced in Chinese hamster ovary cells. Nemolizumab is a glycoprotein (molecular weight: ca. 147,000) composed of 2 H-chains (γ2-chains) consisting of 445 amino acid residues each and 2 L-chains (κ-chains) consisting of 214 amino acid residues each.</p>	<p>(別表 2)</p> <p>登録番号 29-4-B14</p> <p>JAN (日本名) : ネモリズマブ (遺伝子組換え)</p> <p>JAN (英名) : Nemolizumab (Genetical Recombination)</p> <p>(略)</p> <p>ネモリズマブは、遺伝子組換えヒト化モノクローナル抗体であり、マウス抗ヒトインターロイキン-31 受容体モノクローナル抗体の相補性決定部、ヒトフレームワーク部及びヒト IgG2 の定常部からなる。H 鎖の <u>134, 136, 140, 141, 222, 267, 354</u> と <u>418</u> 番目のアミノ酸残基はそれぞれ Ser, Lys, Gly, Gly, Ser, Gln, Gln と Glu に置換されており、C 末端の Gly と Lys は除去されている。ネモリズマブは、チャイニーズハムスター卵巣細胞により産生される。ネモリズマブは、445 個のアミノ酸残基からなる H 鎖 (γ2 鎖) 2 本及び 214 個のアミノ酸残基からなる L 鎖 (κ 鎖) 2 本で構成される糖タンパク質 (分子量 : 約 147,000) である。</p> <p>Nemolizumab is a recombinant humanized monoclonal antibody composed of complementarity-determining regions derived from mouse anti-human interleukin-31 receptor antibody, human framework regions and human IgG2 constant regions. In the H-chain, amino acid residues at position <u>134, 136, 140, 141, 222, 267, 354</u> and <u>418</u> are substituted by Ser, Lys, Gly, Gly, Ser, Gln, Gln and Glu, respectively, and Gly and Lys at the C-terminus are deleted. Nemolizumab is produced in Chinese hamster ovary cells. Nemolizumab is a glycoprotein (molecular weight: ca. 147,000) composed of 2 H-chains (γ2-chains) consisting of 445 amino acid residues each and 2 L-chains (κ-chains) consisting of 214 amino acid residues each.</p>

(下線部変更)