

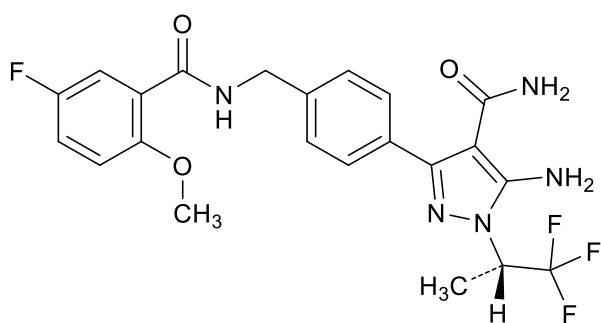
(別表1) INNとの整合性が図られる可能性のあるもの

(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1)

登録番号 303-1-A4

JAN (日本名) : ピルトブルチニブ

JAN (英名) : Pirtobrutinib



$C_{22}H_{21}F_4N_5O_3$

5-アミノ-3-{4-[(5-フルオロ-2-メトキシベンズアミド)メチル]フェニル}-1-[(2S)-1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド

5-Amino-3-{4-[(5-fluoro-2-methoxybenzamido)methyl]phenyl}-1-[(2S)-1,1,1-trifluoropropan-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide

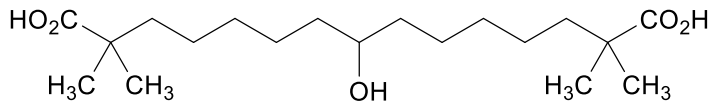
(別表2) INNに記載された品目の我が国における医薬品一般的名称

(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 303-1-B1

JAN (日本名) : ベムペド酸

JAN (英名) : Bempedoic Acid



$C_{19}H_{36}O_5$

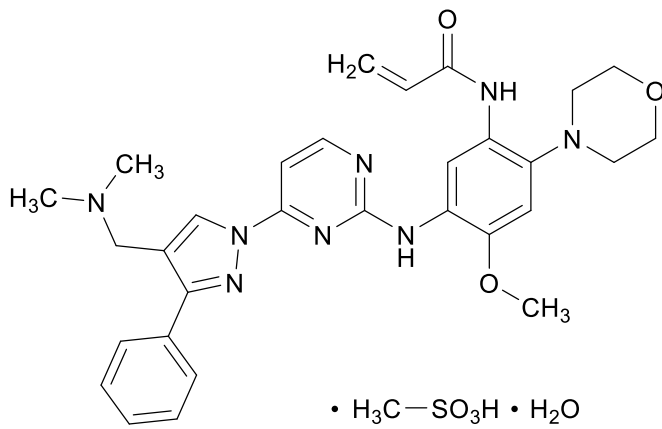
8-ヒドロキシ-2,2,14,14-テトラメチルペンタデカン二酸

8-Hydroxy-2,2,14,14-tetramethylpentadecanedioic acid

登録番号 303-1-B4

JAN（日本名）：ラゼルチニブメシル酸塩水和物

JAN（英名）：Lazertinib Mesilate Hydrate



C₃₀H₃₄N₈O₃ • CH₄O₃S • H₂O

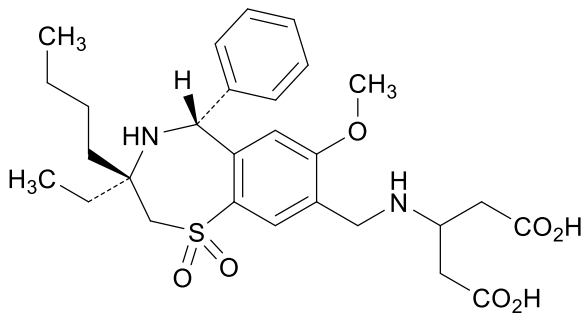
N-{5-[(4-{4-[(ジメチルアミノ)メチル]-3-フェニル-1*H*-ピラゾール-1-イル}ピリミジン-2-イル)アミノ]-4-メトキシ-2-(モルホリン-4-イル)フェニル}プロパ-2-エンアミド一メタンスルホン酸塩一水和物

N-{5-[(4-{4-[(Dimethylamino)methyl]-3-phenyl-1*H*-pyrazol-1-yl}pyrimidin-2-yl)amino]-4-methoxy-2-(morpholin-4-yl)phenyl}prop-2-enamide monomethanesulfonate monohydrate

登録番号 303-1-B5

JAN (日本名) : リネリキシバット

JAN (英名) : Limerixibat



$C_{28}H_{38}N_2O_7S$

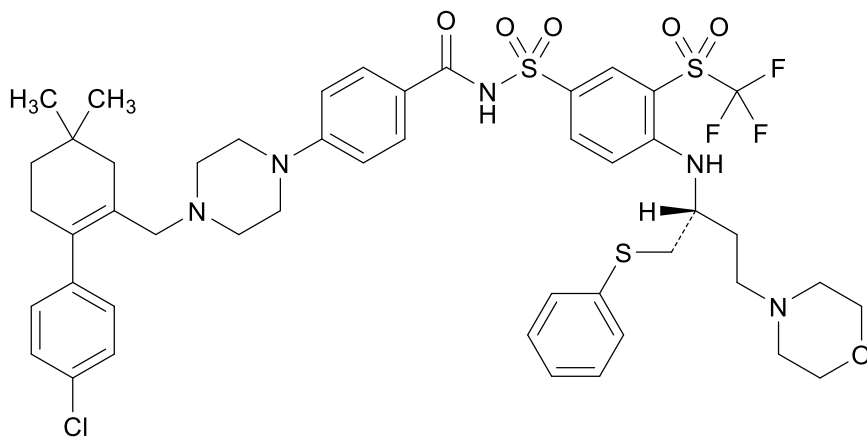
3-({[(3*R*,5*R*)-3-ブチル-3-エチル-7-メトキシ-1,1-ジオキソ-5-フェニル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1*H*-1λ⁶,4-ベンゾチアアゼピン-8-イル]メチル}アミノ)ペンタン二酸

3-({[(3*R*,5*R*)-3-Butyl-3-ethyl-7-methoxy-1,1-dioxo-5-phenyl-2,3,4,5-tetrahydro-1*H*-1λ⁶,4-benzothiazepin-8-yl]methyl}amino)pentanedioic acid

登録番号 303-1-B7

JAN (日本名) : ナビトクラクス

JAN (英名) : Navitoclax



$C_{47}H_{55}ClF_3N_5O_6S_3$

4-(4-{{2-(4-クロロフェニル)-5,5-ジメチルシクロヘキサ-1-エン-1-イル}メチル}ピペラジン-1-イル)-N-[4-{{(2R)-4-(モルホリン-4-イル)-1-(フェニルスルファニル)ブタン-2-イル}アミノ}-3-(トリフルオロメタンスルホニル)ベンゼンスルホニル]ベンズアミド

4-(4-{{2-(4-Chlorophenyl)-5,5-dimethylcyclohex-1-en-1-yl}methyl}piperazin-1-yl)-N-[4-{{(2R)-4-(morpholin-4-yl)-1-(phenylsulfanyl)butan-2-yl}amino}-3-(trifluoromethanesulfonyl)benzenesulfonyl]benzamide

登録番号 303-2-B1

JAN (日本名) : シルガビマブ (遺伝子組換え)

JAN (英名) : Cilgavimab (Genetical Recombination)

アミノ酸配列及びジスルフィド結合

L鎖

DIVMTQSPDS LAVSLGERAT INCKSSQSVL YSSNNKNYLA WYQQKPGQPP
KLLMYWASTR ESGVPDRFSG SGSGAEFTLT ISSLQAEDVA IYYCQQYYST
LTFGGGTKVE IKRTVAAPSV FIFPPSDEQL KSGTASVVCL LNNFYPREAK
VQWKVDNALQ SGNSQESVTE QDSKDSTYSL SSTLTLSKAD YEKHKVYACE
VTHQGLSSPV TKSFNRGEC

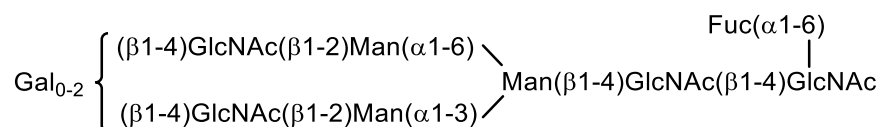
H鎖

EVQLVESGGG LVKPGGSLRL SCAASGFTFR DVWMSWVRQA PGKGLEWVGR
IKSKIDGGTT DYAAPVKGRF TISRDDSKNT LYLQMNSLKT EDTAVYYCTT
AGSYYYDTVG PGLPEGKFDY WQOGTLVTVS SASTKGPSVF PLAPSSKSTS
GGTAALGCLV KDYFPEPVTV SWNSGALTSG VHTFPAVLQS SGLYSLSSVV
TVPSSSLGTQ TYICNVNHKP SNTKVDKRVE PKSCDKTHTC PPCPAPEFEG
GPSVFLFPPK PKDTLYITRE PEVTCVVVDV SHEDPEVKFN WYVDGVEVHN
AKTKPREEQY NSTYRVVSVL TVLHQDWLNG KEYKCKVSNK ALPASIEKTI
SKAKGQPREP QVYTLPPSRE EMTKNQVSLT CLVKGFYPSD IAVEWESNGQ
PENNYKTTTP VLDSDGSFFL YSKLTVDKSR WQQGNVFSCS VMHEALHNHY
TQKLSLSLSPG K

H鎖 N311 : 糖鎖結合 ; H鎖 K461 : 部分的プロセッシング

L鎖 C219-H鎖 C234, H鎖 C240-H鎖 C240, H鎖 C243-H鎖 C243 : ジスルフィド結合

主な糖鎖の推定構造



C₆₆₂₆H₁₀₂₁₈N₁₇₅₀O₂₀₇₈S₄₄ (タンパク質部分, 4本鎖)

H鎖 C₂₂₅₄H₃₄₇₄N₅₉₄O₆₉₄S₁₅

L鎖 C₁₀₅₉H₁₆₃₉N₂₈₁O₃₄₅S₇

シルガビマブは、遺伝子組換え抗 SARS-CoV-2 スパイクタンパク質モノクローナル抗体であり、ヒト IgG1 に由来する。H 鎖の 248, 249, 266, 268, 270 及び 345 番目のアミノ酸残基は、それぞれ Phe, Glu, Tyr, Thr, Glu 及び Ser に置換されている。シルガビマブは、チャイニーズハムスター卵巣細胞により産生される。シルガビマブは、461 個のアミノ酸残基からなる H 鎖 (γ 1 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 152,000) である。

Cilgavimab is a recombinant anti-SARS-CoV-2 spike protein monoclonal antibody derived from human IgG1. In the H-chain, amino acid residues at positions 248, 249, 266, 268, 270 and 345 are substituted by Phe, Glu, Tyr, Thr, Glu and Ser, respectively. Cilgavimab is produced in Chinese hamster ovary cells. Cilgavimab is a glycoprotein (molecular weight: ca. 152,000) composed of 2 H-chains (γ 1-chains) consisting of 461 amino acid residues each and 2 L-chains (κ -chains) consisting of 219 amino acid residues each.

登録番号 303-2-B2

JAN (日本名) : チキサゲビマブ (遺伝子組換え)

JAN (英名) : Tixagevimab (Genetical Recombination)

アミノ酸配列及びジスルフィド結合

L 鎖

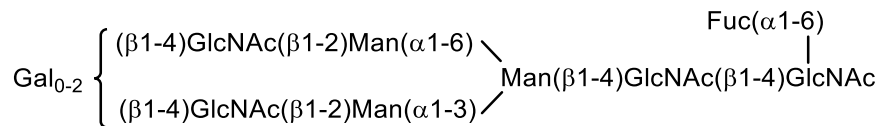
EIVLTQSPGT LSLSPGERAT LSCRASQSVS SSYLAWYQQK PGQAPRLLIY
GASSRATGIP DRFSGSGSGT DFTLTISRLE PEDFAVYYCQ HYGSSRGWTF
GQGTKVEIKR TVAAPSVFIF PPSDEQLKSG TASVVCLLNN FYPREAKVQW
KVDNALQSGN SQESVTEQDS KDSTYLSLST LTLKADYEK HKVYACEVTH
QGLSSPVTKS FNRGEC

H 鎖

QMQLVQSGPE VKKPGTSVKV SCKASGFTFM SSAVQWVRQA RGQRLEWIGW
IVIGSGNTNY AQKFQERVTI TRDMSTSTAY MELSSLRSED TAVYYCAAPY
CSSISCNDFG DIWQGTMTV VSSASTKGPS VFPLAPSSKS TSGGTAALGC
LVKDYFPEPV TVSWNSGALT SGVHTFPAVL QSSGLYSLSS VVTVPSSSLG
TQTYICNVNH KPSNTKVDKR VEPKSCDKTH TCPPCPAPEF EGGPSVFLFP
PKPKDTLYIT REPEVTCVVV DVSHEDPEVK FNWYVDGVEV HNAKTKPREE
QYNSTYRVVS VLTVLHQDWL NGKEYKCKVS NKALPASIEK TISKAKGQPR
EPQVYTLPPS REEMTKNQVS LTCLVKGFYP SDIAVEWESN GQPENNYKTT
PPVLDSDGSF FLYSKLTVDK SRWQQGNVFS CSVMHEALHN HYTQKSLSL
PGK

H 鎖 Q1 : 部分的ピログルタミン酸 ; H 鎖 N303 : 糖鎖結合 ; H 鎖 K453 : 部分的プロセッシング
L 鎖 C216-H 鎖 C226, H 鎖 C232-H 鎖 C232, H 鎖 C235-H 鎖 C235 : ジスルフィド結合

主な糖鎖の推定構造



C₆₄₈₈H₁₀₀₃₄N₁₇₄₆O₂₀₃₈S₅₀ (タンパク質部分, 4 本鎖)

H 鎖 C₂₂₀₉H₃₄₁₇N₅₈₉O₆₈₄S₂₀

L 鎖 C₁₀₃₅H₁₆₀₄N₂₈₄O₃₃₅S₅

チキサゲビマブは、遺伝子組換え抗 SARS-CoV-2 スパイクタンパク質モノクローナル抗体であり、ヒト IgG1 に由来する。H 鎖の 240, 241, 258, 260, 262 及び 337 番目のアミノ酸残基は、それぞれ Phe, Glu, Tyr, Thr, Glu 及び Ser に置換されている。チキサゲビマブは、チャイニーズハムスター卵巣細胞により産生される。チキサゲビマブは、461 個のアミノ酸残基からなる H 鎖 (γ 1 鎖) 2 本及び 216 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。

Tixagevimab is a recombinant anti-SARS-CoV-2 spike protein monoclonal antibody derived from human IgG1. In the H-chain, amino acid residues at positions 240, 241, 258, 260, 262 and 337 are substituted by Phe, Glu, Tyr, Thr, Glu and Ser, respectively. Tixagevimab is produced in Chinese hamster ovary cells. Tixagevimab is a glycoprotein (molecular weight: ca. 149,000) composed of 2 H-chains (γ 1-chains) consisting of 461 amino acid residues each and 2 L-chains (κ -chains) consisting of 216 amino acid residues each.

登録番号 303-2-B3

JAN (日本名) : ペグバリアーゼ (遺伝子組換え)

JAN (英名) : Pegvaliase (Genetical Recombination)

アミノ酸配列

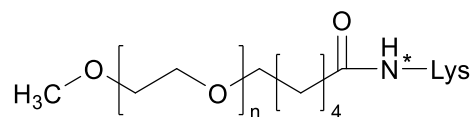
```
MKTLTSAQSK TSSQQFSFTG NSSANVIIGN QKLTINDVAR VARNGTLVSL
TNNTDILQGI QASCDYINNA VESGEPIYGV TSGFGGMANV AISREQASEL
QTNLVWFLKT GAGNKLPLAD VRAAMLLRAN SHMRGASGIR LELIKRMEIF
LNAGVTPYVY EFGSIGASGD LVPLSYITGS LIGLDPSFKV DFNGKEMDAP
TALRQLNLSP LTLLPKEGLA MMNGTSVMTG IAANCVYDTQ ILTAIAMGVH
ALDIQALNGT NQSFHPFIHN SKPHPGQLWA ADQMISLLAN SQLVRDELDG
KHDYRDHELI QDRYSLRCLP QYLGPIVDGI SQIAKQIEIE INSVTDNPLI
DVDNQASYHG GNFLGQYVGM GMDHLRYYIG LLAKHLDVQI ALLASPEFSN
GLPPSLLGNR ERKVMNGLKG LQICGNSIMP LLTFYGN SIA DRFPTHAEQF
NQNINSQGYT SATLARRSVD IFQNYVAIAL MFGVQAVDLR TYKKTGHYDA
RASLSPATER LYSAVRHVVG QKPTSDRPYI WNDNEQGLDE HIARISADIA
AGGVIVQAVQ DILPSLH
```

4

K10, K32, K115, K145, K195, K301, K335, K413, K493, K494, K522 : 主な PEG 結合部位

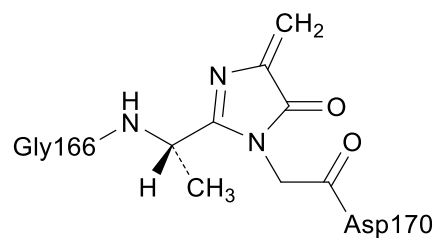
A167-S168-G169 : メチリデンイミダゾロン化部位

ポリエチレングリコールの結合様式



*Lys残基のε-アミノ基

メチリデンイミダゾロン部の構造



C₁₀₉₀₄H₁₇₂₈₄N₃₀₅₂O₃₃₁₂S₈₀ (タンパク質部分, 4 量体)

単量体 C₂₇₂₆H₄₃₂₁N₇₆₃O₈₂₈S₂₀

ペグバリアーゼは、遺伝子組換え *Anabaena variabilis* フェニルアラニンアンモニアリアーゼ (EC 4.3.1.24) 類縁体であり、503 及び 565 番目のアミノ酸残基はそれぞれ Ser に置換され、167~169 番目の Ala-Ser-Gly からメチリデンイミダゾロンが形成され、サブユニット当たり平均 9 個のメトキシポリエチレングリコール鎖 (分子量: 約 20,000) がカルボニル基を介して結合している (主な PEG 結合部位: Lys 残基)。ペグバリアーゼは、567 個のアミノ酸残基からなるサブユニット 4 個から構成される PEG 化タンパク質 (分子量: 約 917,000) である。

Pegvaliase is a recombinant *Anabaena variabilis* phenylalanine ammonia-lyase (EC 4.3.1.24) analogue, whose amino acid residues at positions 503 and 565 are substituted by Ser, respectively, and in which methyldene imidazolone is formed from Ala-Ser-Gly at positions 167-169, in addition, to which an average of approximately 9 methoxy polyethylene glycol polymers (molecular weight: ca. 20,000) per subunit are bound via carbonyl groups (major pegylation sites: Lys residues). Pegvaliase is a pegylated protein (molecular weight: ca. 917,000) composed of 4 subunits consisting of 567 amino acid residues each.

※ JAN 以外の情報は、参考として掲載しました。