

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018（2019年更新版）に準拠して作成

放射性医薬品・肝機能診断薬

## アシアロシンチ®注

放射性医薬品基準 ガラクトシル人血清アルブミン  
ジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム(<sup>99m</sup>Tc)注射液

ASIALOSCINTI®Injection

剤形	注射剤
製剤の規制区分	生物由来製品、処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1バイアル（1mL）中 ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム( <sup>99m</sup> Tc) （検定日時において）185MBq
一般名	和名：ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム ( <sup>99m</sup> Tc)注射液 洋名：Technetium( <sup>99m</sup> Tc)Galactosyl Human Serum Albumin Diethylenetriamine Pentaacetic Acid Injection
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：1992年7月3日 薬価基準収載年月日：1992年8月28日 販売開始年月日：1992年8月31日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元 日本メジフィジックス株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	日本メジフィジックス株式会社 担当〔 〕 TEL〔 〕
問い合わせ窓口	日本メジフィジックス株式会社 製品問い合わせ専用フリーダイヤル ☎ 0120-07-6941 医療関係者専用ホームページ <a href="https://www.nmp.co.jp/member/index.html">https://www.nmp.co.jp/member/index.html</a>

®：登録商標

本IFは2022年3月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。  
最新の情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

～日本病院薬剤師会～

(2020年4月改訂)

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

## 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、  
「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには  
十分留意すべきである。

#### 4. 利用に際しての留意点

I Fを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I F  
は日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品  
適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、  
有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コー  
ド・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインで  
は、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応  
じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などによ  
り、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。  
製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使  
用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていた  
いただきたい。

# 目 次

I. 概要に関する項目	1	8. トランスポーターに関する情報	15
1. 開発の経緯	1	9. 透析等による除去率	15
2. 製品の治療学的特性	1	10. 特定の背景を有する患者	15
3. 製品の製剤学的特性	1	11. その他	15
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	16
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	16
6. RMPの概要	2	2. 禁忌内容とその理由	16
II. 名称に関する項目	3	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	16
1. 販売名	3	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	16
2. 一般名	3	5. 重要な基本的注意とその理由	16
3. 構造式又は示性式	3	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	16
4. 分子式及び分子量	3	7. 相互作用	17
5. 化学名（命名法）又は本質	3	8. 副作用	17
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
III. 有効成分に関する項目	4	10. 過量投与	17
1. 物理化学的性質	4	11. 適用上の注意	18
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	12. その他の注意	18
3. 有効成分の確認試験法，定量法	4	IX. 非臨床試験に関する項目	19
IV. 製剤に関する項目	6	1. 薬理試験	19
1. 剤形	6	2. 毒性試験	19
2. 製剤の組成	6	X. 管理的事項に関する項目	21
3. 添付溶解液の組成及び容量	6	1. 規制区分	21
4. 力価	6	2. 有効期間	21
5. 混入する可能性のある夾雑物	7	3. 包装状態での貯法	21
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	4. 取扱い上の注意	21
7. 調製法及び溶解後の安定性	7	5. 患者向け資材	21
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7	6. 同一成分・同効薬	21
9. 溶出性	7	7. 国際誕生年月日	21
10. 容器・包装	7	8. 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準 収載年月日，販売開始年月日	21
11. 別途提供される資材類	7	9. 効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等 の年月日及びその内容	21
12. その他	7	10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその 内容	22
V. 治療に関する項目	8	11. 再審査期間	22
1. 効能又は効果	8	12. 投薬期間制限に関する情報	22
2. 効能又は効果に関連する注意	8	13. 各種コード	22
3. 用法及び用量	8	14. 保険給付上の注意	22
4. 用法及び用量に関連する注意	8	XI. 文献	23
5. 臨床成績	8	1. 引用文献	23
VI. 薬効薬理に関する項目	10	2. その他の参考文献	23
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10	XII. 参考資料	24
2. 薬理作用	10	1. 主な外国での発売状況	24
VII. 薬物動態に関する項目	11	2. 海外における臨床支援情報	24
1. 血中濃度の推移	11	XIII. 備考	25
2. 薬物速度論的パラメータ	12	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うに あたっての参考情報	25
3. 母集団（ポピュレーション）解析	12	2. その他の関連資料	25
4. 吸収	12		
5. 分布	12		
6. 代謝	14		
7. 排泄	14		

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

肝疾患の診断上、残存する肝細胞の総能力(肝予備能)を評価することが重要であるが、既存の検査法のみでは十分な情報が得られない場合があることから、臨床使用が容易な新しい手法の開発が望まれていた。

ヒトの肝細胞表面にはアシアロ糖たん白(以下、ASGP)に対する受容体<sup>1)</sup>が存在するが、この受容体は肝癌組織にはほとんど存在しないこと<sup>2)</sup>、肝硬変では減少し<sup>2)</sup>、組織学的な小葉改築の進行や偽小葉形成の程度と受容体量が相関すること<sup>3)</sup>が報告されている。

これらは、ASGP 受容体量が肝細胞量を反映することを示している。たん白にガラクトースを結合させた合成糖たん白(以下、合成糖たん白)は、天然の ASGP と等価に ASGP 受容体に認識され、肝細胞に摂取される<sup>4)</sup>。この原理を利用して、放射性核種で標識した合成糖たん白を投与することにより ASGP 受容体の量を非侵襲的に評価し得ることが示されている<sup>5)~7)</sup>。

当社では、人血清アルブミンにガラクトース残基を導入した合成糖たん白を<sup>99m</sup>Tc 標識した安定な既調製注射剤を開発し、1992年7月、「シンチグラフィによる肝臓の機能及び形態の診断」を効能・効果とする「アシアロシンチ<sup>®</sup>注」(以下、本剤)の製造承認を取得した。2001年12月に薬機法第14条第2項各号(承認拒否事由)のいずれにも該当しないとの再審査結果を得た。

## 2. 製品の治療学的特性

1. 本剤は、アルブミンにガラクトースを結合させた合成糖たん白であり、天然の ASGP と生理的に等価に ASGP 受容体に取り込まれる。ASGP 受容体量は肝疾患の病態によって減少するため、放射性核種で標識した合成糖たん白を投与し肝集積を評価することで肝機能を診断することが可能である。(「VI. 2. (1)作用部位・作用機序」の項参照)
2. 本剤のシンチグラム所見により肝機能障害の重症度を視覚的に判定することが可能である。(「V. 5. (4)検証的試験」の項参照)

## 3. 製品の製剤学的特性

1. 本剤は、<sup>99m</sup>Tc に対して強い配位能力を有するジエチレントリアミン五酢酸(DTPA)をバイファンクショナルキレート剤としてたん白に導入し、放射化学的純度と生体内での安定性の向上を図っている。(「II. 3. 構造式又は示性式」の項参照)
2. 本剤は<sup>99m</sup>Tc 標識製剤であり、<sup>99m</sup>Tc は、141keV の $\gamma$ 線を放出すること、半減期(6.0067時間)が短いこと、 $\beta$ 線を放出しないため被検者の被曝が少ないことなど、シンチグラフィのための優れた特徴を有している。(「III. 1. (7)その他の主な示性値」の項参照)

## 4. 適正使用に関して周知すべき特性

該当しない

## 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

### (1) 承認条件

該当しない

### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

## 6. RMP の概要

該当しない

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

アシアロシンチ<sup>®</sup>注

#### (2) 洋名

ASIALOSCINTI<sup>®</sup>Injection

#### (3) 名称の由来

ASGP(アシアロ糖たん白)受容体量をシンチグラフィで評価しようとするところから命名

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム(<sup>99m</sup>Tc)注射液(放射性医薬品基準)

#### (2) 洋名 (命名法)

Technetium(<sup>99m</sup>Tc) Galactosyl Human Serum Albumin Diethylenetriamine Pentaacetic Acid Injection

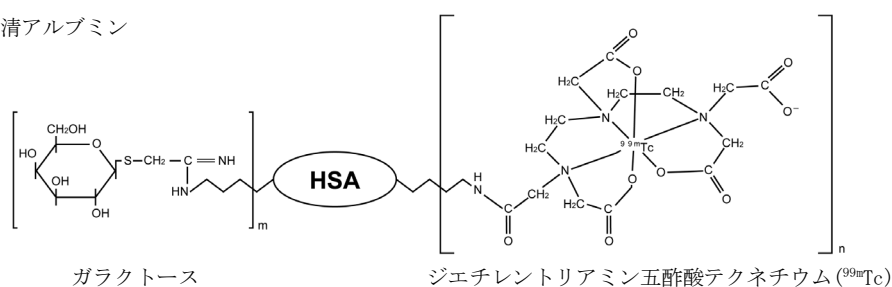
#### (3) ステム(stem)

不明

### 3. 構造式又は示性式

推定構造式<sup>8), 9)</sup>

m=30~40, n=4~7, HSA: 人血清アルブミン



### 4. 分子式及び分子量

分子式: 詳細構造式が未確定のため, 特定できず

分子量<sup>10)</sup>: 約 76,000

### 5. 化学名(命名法)又は本質

詳細構造式が未確定のため, 命名できず

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

<sup>99m</sup>Tc-GSA

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

本項目は、ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム( $^{99m}\text{Tc}$ )について記載する。

### 1. 物理化学的性質

#### (1) 外観・性状

該当資料なし

#### (2) 溶解性

該当資料なし

#### (3) 吸湿性

該当資料なし

#### (4) 融点（分解点），沸点，凝固点

該当資料なし

#### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

#### (6) 分配係数

該当資料なし

#### (7) その他の主な示性値

本項目は  $^{99m}\text{Tc}$  の核物理学的特性について記載する。

[ $^{99m}\text{Tc}$  の核物理学的特性]

1. 物理的半減期<sup>11)</sup> : 6.0067 時間
2. 主  $\gamma$  線のエネルギー : 141keV (89.1%)

### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

### 3. 有効成分の確認試験法，定量法

確認試験

#### (1) テクネチウム 99m

放射性医薬品基準一般試験法ガンマ線測定法の Ge 半導体検出器による測定法により試験を行うとき，0.141MeV にピークを認める。

#### (2) 放射化学的異物

バルビタール緩衝液(pH8.6，イオン強度 0.06)を用いて適当な条件下でセルロースアセテート膜を用いる電気泳動法により試験を行うとき，ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム( $^{99m}\text{Tc}$ )以外の放射能は泳動膜上の総放射能の 12%以下である。



なお、ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム( $^{99m}\text{Tc}$ )の位置は、ポンソー3R 試液を噴霧したときの発色により確認する(原線から陽極側 1.5~3.5cm)。

#### 定量法

適当量について、放射性医薬品基準一般試験法ガンマ線測定法の放射線の定量により放射能を測定する。

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

注射剤（溶液）

#### (2) 製剤の外観及び性状

外観：無色澄明の液

#### (3) 識別コード

該当しない

#### (4) 製剤の物性

pH：2.5～4.0

浸透圧比：約 1（生理食塩液に対する比）

#### (5) その他

注射剤の容器中の特殊な気体：アルゴンガス

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	アシアロシンチ <sup>®</sup> 注
有効成分	1 バイアル（1mL）中 ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム （ <sup>99m</sup> Tc）（検定日時において）185MBq ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸 3mg
添加剤	1 バイアル（1mL）中 無水塩化第一スズ 19 $\mu$ g, 日本薬局方アスコルビン酸 88 $\mu$ g, 日本薬局方 生理食塩液, pH 調整剤

本剤の成分であるガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸には人血清アルブミン（採血国：日本，献血）が使用されている。

#### (2) 電解質等の濃度

該当しない

#### (3) 熱量

該当しない

### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

### 4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当しない

6. 製剤の各種条件下における安定性

試験名	保存条件 (温度)	容器	保存期間	結果
長期保存試験	25±2℃	放射線遮蔽用鉛容器に収納したガラス製バイアル、ゴム栓、アルミキャップから構成される容器	30 時間	規格内
苛酷試験	40℃		24 時間	規格内

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装，外観が特殊な容器・包装に関する情報

ガラス製バイアルは，放射線遮蔽用鉛容器に収められている。

(2) 包装

185MBq (1mL) [1 バイアル]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

バイアル：ガラス

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

シンチグラフィによる肝臓の機能及び形態の診断

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

通常、成人には 185MBq (1mL) を静脈内投与し、胸腹部前面に検出器を向け、投与直後から経時的にシンチグラムを得ると共に、データ収集及び処理を行うことにより、肝機能指標を得る。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

第1相臨床試験<sup>12)</sup>では、健常成人男子7例を対象に、ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸（以下、GSA）量を1, 5, 10 mgの投与群に分け、放射エネルギー185MBqが投与された。いずれの投与量においても、本剤に起因すると考えられる症状の変化及び臨床検査値の異常は認められなかったが、血中保持率及び肝集積曲線から、肝疾患患者を対象とする場合には、5, 10 mgは過多であると考えられた。

第2相臨床試験<sup>13)</sup>では、肝疾患患者81例を対象に185MBq、GSA量として1または3mgが投与された。3mg投与群の方がほとんどの検討項目について既存の肝機能検査に対する相関係数が高値を示し、肝障害の中等度から重症の症例において、肝障害の重症度分離が良好であった。このため投与量として、GSA量3mg、放射エネルギー185MBqが適切と考えられた。なお、この試験で本剤が投与された全例において、安全性に問題はみられなかった。

### 4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

国内第Ⅲ相試験

肝疾患患者460例を対象に有効性が検討され、460例中判定不能とされた1例を除く459例(99.8%)で本剤の有効性が次のとおり認められた。

急性肝炎、慢性肝炎、肝硬変、アルコール性慢性肝炎、脂肪肝、閉塞性黄疸、肝腫瘍、その他の肝疾患

疾患名	有効例数/症例数	有効率
急性肝炎	13/13	100%
慢性肝炎 <sup>注</sup>	372/373	99.7%
閉塞性黄疸	13/13	100%
肝腫瘍	35/35	100%
その他の肝疾患	26/26	100%

注：慢性肝炎は肝硬変、アルコール性慢性肝炎、脂肪肝を含む

更に、本剤のシンチグラム所見によって、肝の形態のみならず肝機能障害の重症度を視覚的に判定することも可能であった<sup>14)</sup>。

本剤の血中消失及び肝集積に基づく肝機能指標の臨床的有効性について、以下のような知見が得られた<sup>14)</sup>。

- ・慢性肝疾患では肝障害の進行に伴って有意な変化を示し、従来の肝機能検査、特に肝予備能を反映するとされている ICG 検査、CTC スコアと高い相関を示し、新しい肝機能指標として有効であると考えられた。
- ・急性肝疾患では病態の重症度に応じた値が得られ、血液凝固系の臨床検査値とも有意な相関を示し、急性期の病態を反映した肝機能評価が可能であった。
- ・高度の黄疸を有する患者でも、血清中のビリルビンに影響されることなく肝機能进行评估することが可能であった。
- ・肝切除術前後では、術前後の肝細胞数の変化を反映すると考えられる肝機能指標が得られた。全 576 例に対し、本剤に起因する異常所見は認められなかった。

## 2) 安全性試験

該当資料なし

## (5) 患者・病態別試験

該当資料なし

## (6) 治療的使用

- 1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当しない

- 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

## (7) その他

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

該当しない

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

測定法

本剤の有効成分に含まれる放射性核種から放出される放射線（ガンマ線）が核医学検査装置により画像化される。

集積機序

アシアロ糖たん白（ASGP）受容体は、哺乳類の肝細胞にのみ存在し、ASGP のガラクトース残基を認識して ASGP を肝細胞内に取り込む<sup>1)</sup>。アルブミンにガラクトースを結合させた本剤のような合成糖たん白も、天然の ASGP と生理的に等価に ASGP 受容体に取り込まれる<sup>4)</sup>。ASGP 受容体量は肝疾患の病態によって減少することが知られており<sup>2)</sup>、放射性核種で標識した合成糖たん白を投与し体内での肝集積の様相を評価することによって肝機能を診断することができる<sup>12)~14)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

1) ガラクトサミン急性肝障害ラットにおいて、合成糖たん白の血中消失曲線又は肝集積曲線を解析して得られた指標が ASGP 受容体活性と密に相関することを示した<sup>5)</sup>。また、①四塩化炭素慢性肝障害ラットにおいても、合成糖たん白の血中消失曲線又は肝集積曲線を解析して得られた指標が ASGP 受容体活性と相関すること、②ガラクトサミン急性肝障害ラットにおいて、ASGP 受容体活性が肝細胞障害度の指標である AST (GOT) 及び肝臓での合成能の指標であるコレステロールエステル比と相関すること、及び③四塩化炭素慢性肝障害ラットにおいて、ASGP 受容体活性が肝線維化の程度（ヒドロキシプロリン含量）及び肝代謝能（チトクローム P<sub>450</sub> 及び b<sub>5</sub> 含量）と強く相関することを示した<sup>6)</sup>。

2) 合成糖たん白を肝疾患患者に投与し、得られた時間放射能曲線をコンパートメント解析することにより肝血流量及び ASGP 受容体量を推定し、両者が共に低下を示した症例では短期予後が不良であった<sup>7)</sup>。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当しない

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当しない

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

健常成人男子に、ガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸（GSA-DTPA）量として 1 mg, 5 mg及び 10 mg, テクネチウム 99mとして 185MBqの  $^{99m}\text{Tc}$ -GSA を静注し、血中放射能の経時変化を検討した（図）。

静注後、15, 30 及び 60 分における血中残存率は、1 mg投与例（3 例）ではそれぞれ  $24.1 \pm 2.8\%$ ,  $16.2 \pm 2.0\%$ 及び  $11.5 \pm 1.1\%$ であり、10 mg投与例（1 例）では  $40.9\%$ ,  $27.9\%$ 及び  $18.8\%$ であり、5 mg投与例（1 例）ではこれらの間であった。静注後 4~60 分の血中消失曲線は 2 相性で近似され、初期相及び後期相の半減期は、1 mg投与例では  $10.9 \pm 0.4$  分及び  $61.9 \pm 6.5$  分、5 mg投与例では 13.3 分及び 49 分、及び 10 mg投与例では 19.1 分及び 51.9 分であった。投与後初期においては投与量が少ないほど血中消失半減期が短くなる傾向が認められたが、後期相では差がみられず、それ以後の血中消失の様相に投与量による差はないものと考えられた<sup>12)</sup>。

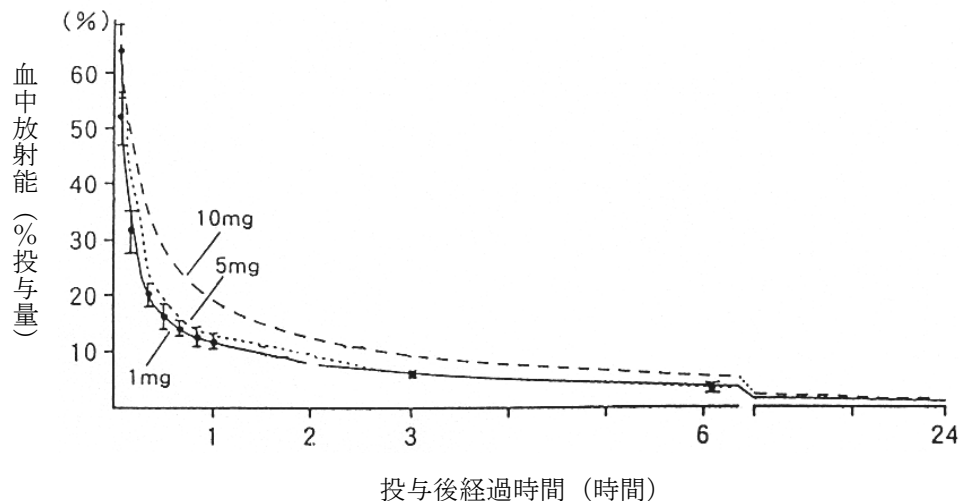


図 血中放射能（血中残存率）の経時変化（平均値±標準偏差）

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

## 2. 薬物速度論的パラメータ

### (1) 解析方法

該当資料なし

### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

### (3) 消失速度定数

該当資料なし

### (4) クリアランス

該当資料なし

### (5) 分布容積

該当資料なし

### (6) その他

該当しない

## 3. 母集団（ポピュレーション）解析

### (1) 解析方法

該当資料なし

### (2) パラメータ変動要因

該当資料なし

## 4. 吸収

該当資料なし

## 5. 分布

### (1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

### (2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

### (3) 乳汁への移行性

該当資料なし

### (4) 髄液への移行性

該当資料なし



(5) その他の組織への移行性

健常成人男子に、GSA-DTPA 量として 1 mg, 5 mg 及び 10 mg, テクネチウム 99m として 185MBq の <sup>99m</sup>Tc-GSA を静注し、肝臓、胆のう及び腸管(糞中を含む)における放射能の経時変化を検討した(図)。肝臓への集積は静注後 30 分~1 時間でプラトーとなり、その後の減少は緩徐であった。プラトーに達するまでの時間は 1mg 投与例がそのほかの例よりも速かった。プラトー時における肝集積率は 1mg 投与例(3 例)では 60%(57~62%), 10mg 投与例では 58%であった。5mg 投与例(1 例)では 48%とほかの例よりも低値であった。静注後 24 時間における肝集積率は、1mg 投与例(3 例)では 39%(36~42%), 5mg 投与例(1 例)では 27%, 10mg 投与例(1 例)では 30%であった。胆のうにおける放射能は静注後 2 時間前後に最大となり、その後腸管から糞中へ移行した<sup>12)</sup>。

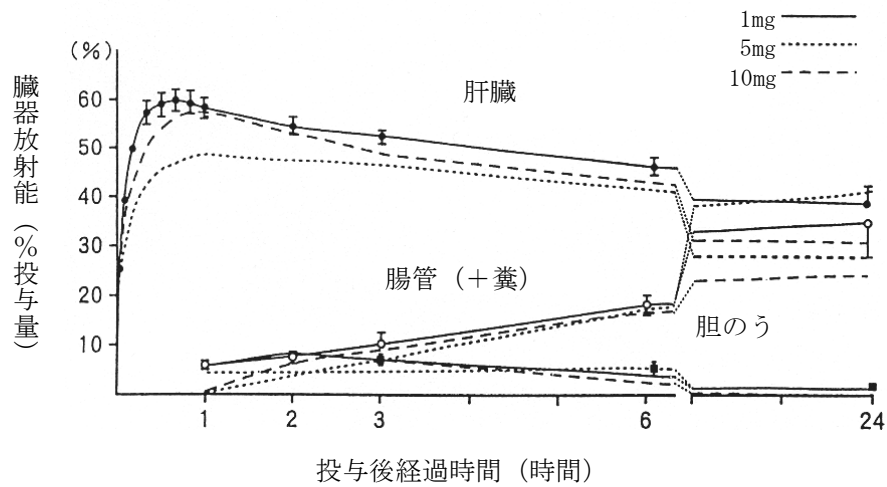


図 主要臓器の放射能経時変化(平均値±標準偏差)

[吸収線量]

MIRD 法により算出した吸収線量は次のとおりである。

	吸収線量 (mGy/MBq)
肝臓	0.054
胆のう	0.065
小腸	0.026
大腸上部	0.049
大腸下部	0.030
腎臓	$8.1 \times 10^{-3}$
膀胱	0.015
赤色骨髄	$5.4 \times 10^{-3}$
卵巣	0.010
精巣	$1.1 \times 10^{-3}$
全身	$4.6 \times 10^{-3}$

## (6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

血中の放射化学的成分は、その 80%前後が本剤の未変化体であると考えられるたん白成分であり、本剤は血液中で比較的安定に存在することが示唆された。また、尿中の放射化学的成分はほとんどが低分子成分であり、肝臓で分解されて生じた低分子成分が再び血液中に放出された後、尿中に排泄されたものと考えられた<sup>12)</sup>。

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種, 寄与率

該当資料なし

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

### (4) 代謝物の活性の有無及び活性比, 存在比率

該当資料なし

## 7. 排泄

健常成人男子に、GSA-DTPA 量として 1 mg, 5 mg及び 10 mg, テクネチウム 99m として 185MBq の <sup>99m</sup>Tc-GSA を静注し、GSA-DTPA の投与量別の累積尿中排泄率を検討した(図)。

投与後 24 時間までの累積尿中排泄率は 17~28%, 累積糞中排泄率は 24~46%であり、主排泄経路は胆道~糞中であつた<sup>12)</sup>。

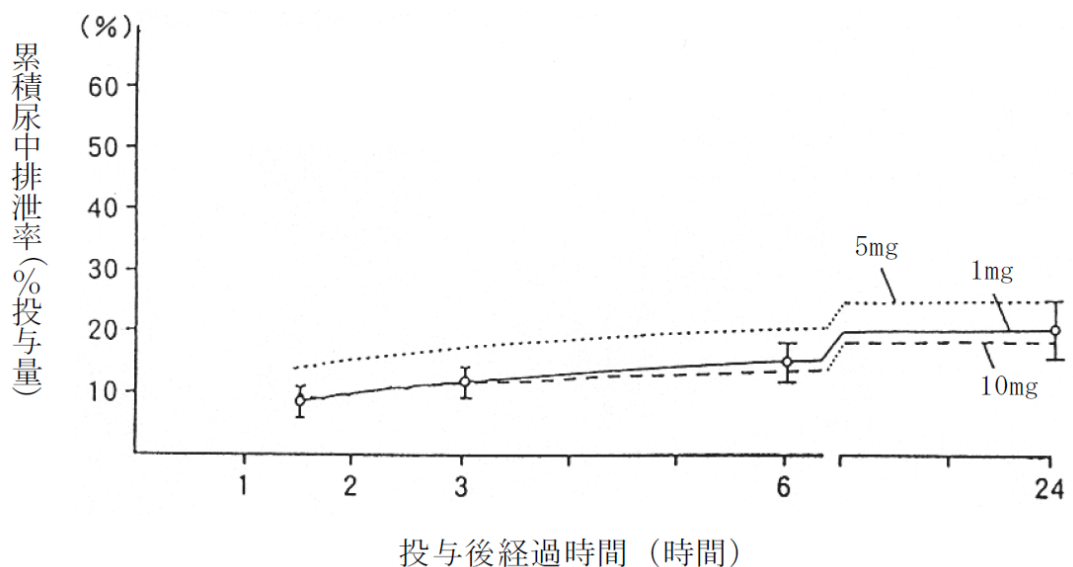


図 尿中の累積放射能経時変化 (平均値±標準偏差)

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### ◆冒頭部分の注意事項

本剤は、貴重な血液を原料として製剤化されたものです。問診、感染症関連の検査等の安全対策を講じていますが、血液を原料としていることに由来する感染症の伝播等の危険性を完全に排除することはできないことから、疾病の診断上の必要性を十分に検討の上、必要最小限の使用にとどめるようお願いいたします。

#### 1. 警告内容とその理由

設定されていない

#### 2. 禁忌内容とその理由

設定されていない

#### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

#### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

#### 5. 重要な基本的注意とその理由

##### 8. 重要な基本的注意

診断上の有益性が被曝による不利益を上回ると判断される場合にのみ投与することとし、投与量は最小限度にとどめること。

#### 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

##### (1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

##### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

##### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

##### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

##### (5) 妊婦

##### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、診断上の有益性が被曝による不利益を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

(6) 授乳婦

**9.6 授乳婦**

診断上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

**9.7 小児等**

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

**9.8 高齢者**

患者の状態を十分に観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

**11. 副作用**

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(2) その他の副作用

**11.2 その他の副作用**

	頻度不明
過敏症	発疹
消化器	嘔吐，嘔気
その他	顔面潮紅

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

**11. 適用上の注意**

設定されていない

**12. その他の注意**

**(1) 臨床使用に基づく情報**

設定されていない

**(2) 非臨床試験に基づく情報**

設定されていない

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照

#### (2) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (3) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

#### (1) 単回投与毒性試験

マウス及びラット、ビーグル犬を用いてガラクトシル人血清アルブミンジエチレントリアミン五酢酸 (GSA-DTPA) の静脈内投与による単回投与毒性試験を実施した。マウスの毒性試験で一過性の症状発現を認めたため、追加試験として、マウスに対して用量を3段階設定し、これら症状と投与量との関係を検討した。

また、マウス及びラットに減衰させた本剤を静脈内投与し、単回投与毒性試験を実施した。マウスの毒性試験で一過性に認められた自発運動低下などの一般状態の変化が、被験物質由来の影響であることを確認するため、追加試験として、マウスに対して用量を3段階設定し、安全性確認試験を実施した。

被験物質	動物種 (n数/群)	投与方法 観察期間	投与量 (mg/kg : GSA-DTPA として)	主な所見	概略の 致死量 (mg/kg)
GSA-DTPA	Crj : CD-1系 マウス (雄雌各10)	静脈内 14日間	0, 2000 <sup>a</sup>	自発運動低下など一般症状の変化が認められたが、4時間で回復した。10日後に体重減少または体重増加抑制が認められたが14日後に回復した。	LD <sub>50</sub> 値 : >2000
	Crj : CD-1系 マウス (雌5)	静脈内 3日間	0, 200, 500, 1000	一般症状の変化が認められたが、2時間で回復した。体重変化、剖検結果に異常はなかった。認められた症状は被験物質に特異的なものではないと考えられた。	>1000
	Crj : CD系 ラット (雄雌各10)	静脈内 14日間	0, 2000 <sup>a</sup>	一般状態、血液学的検査、血液生化学的検査に異常なし。	LD <sub>50</sub> 値 : >2000
	ビーグル犬 (雄2)	静脈内 14日間	0, 41.2, 206.0	一般状態、体重、摂餌量に異常なし。206.0mg/kg投与群で血清ALPの増加傾向、潜血尿が認められたが、その他の変化は認められなかった。	無毒性量 41.2

減衰させた 本剤	Crj : CD-1 系 マウス (雄雌各 10)	静脈内 14 日間	0, 567.5 <sup>b</sup>	全例で自発運動低下など一過性の一般症状 の変化が認められたが, 3 時間で回復し た。被験物質投与群の雄及び対照群の雌雄 で軽度の体重減少が認められたが, 3~10 日後に回復した。剖検所見に異常はなかつ た。	>567.5
	Crj : CD-1 系 マウス (雌 5)	静脈内 3 日間	0, 50, 100, 200	一般症状の変化が認められたが, 2 時間で 回復した。体重変化, 剖検結果に異常はな かつた。認められた症状は被験物質に特異 的なものではないと考えられた。	>200
	Crj : CD 系 ラット (雄雌各 10)	静脈内 14 日間	0, 113.5 <sup>c</sup>	一般状態, 体重変化に異常は認められなかつ た。剖検の結果, 被験物質の投与群及び 対照群の各 1 例に腎盂の拡張が認められた が, 本系統のラットでしばしば認められる 所見であり, 被験物質の影響ではなかつ た。	>113.5

a : 臨床最大用量の 40,000 倍

b : 臨床最大用量の 3,000 倍

c : 臨床最大用量の 600 倍

## (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

## (3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

## (4) がん原性試験

該当資料なし

## (5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

## (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

## (7) その他の特殊毒性

該当資料なし



## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製剤：アシアロシンチ<sup>®</sup>注 生物由来製品，処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

### 2. 有効期間

製造日時から 30 時間，ただし検定日時から 5 時間

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

#### 20. 取扱い上の注意

本剤は，医療法その他の放射線防護に関する法令，関連する告示及び通知等を遵守し，適正に使用すること。

放射性医薬品を診療使用する際には，医療法（第 7 条）に基づく許可及び医療法施行規則（第 28 条）に基づく届出を行うこと。

放射性医薬品であるため管理区域内で使用すること。

使用に際しては放射線を適切に遮蔽すること。

### 5. 患者向け資材

患者向け医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：なし

その他の患者向け資材：なし

### 6. 同一成分・同効薬

該当しない

### 7. 国際誕生年月日

1992 年 7 月 3 日（日本）

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日

製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
1992 年 7 月 3 日	20400AMZ00901000	1992 年 8 月 28 日	1992 年 8 月 31 日

### 9. 効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果通知年月日 2001年12月10日

医薬品，医療機器等の品質，有効性及び安全性の確保等に関する法律第14条第2項第3号（承認拒否事由）イからハまでのいずれにも該当しない。

11. 再審査期間

6年：1992年7月3日～1998年7月2日（終了）

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は，投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT(13桁)番号	レセプト電算処理 システム用コード*
アジアロシンチ®注	4300435A1020	4300435A1020	1092929010101	644300004

14. 保険給付上の注意

該当しない

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) Ashwell G, et al. : Advan Enzymol, 1974 ; 41 : 99-128 (PMID : 4609051)
- 2) Sawamura T, et al. : Gastroenterology, 1984 ; 87 : 1217-1221 (PMID : 6092193)
- 3) 内藤雄二 : 肝臓, 1987 ; 28 : 1179-1187
- 4) Stowell CP, et al. : J Biol Chem, 1978 ; 253 : 6107-6110 (PMID : 681342)
- 5) 河相吉, 他 : 核医学, 1986 ; 23 : 907-916 (PMID : 3784120)
- 6) 羽間 弘, 他 : 核医学, 1986 ; 23 : 917-926 (PMID : 3784121)
- 7) Stadalnik RC, et al. : J Nucl Med, 1985 ; 26 : 1233-1242 (PMID : 2997417)
- 8) Stowell CP, et al. : Adv Carbohydr Chem Biochem, 1980 ; 37 : 225-281 (PMID : 6996450)
- 9) Krejcarek GE, et al. : Biochem Biophys Res Commun, 1977 ; 77 : 581-585 (PMID : 409400)
- 10) 日本放射性医薬品協会 放射性医薬品基準解説書作成検討会編集 : 放射性医薬品基準 解説書, 2016
- 11) 日本アイソトープ協会編集 : アイソトープ手帳 12 版, 丸善出版 (東京), 2020
- 12) 鳥塚莞爾, 他 : 核医学, 1991 ; 28 : 1321-1331 (PMID : 1770647)
- 13) 鳥塚莞爾, 他 : 核医学, 1992 ; 29 : 85-95 (PMID : 1578824)
- 14) 鳥塚莞爾, 他 : 核医学, 1992 ; 29 : 159-181 (PMID : 1564788)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

海外の主要な国では販売されていない（2022年8月時点）

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XIII. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

#### (1) 粉碎

該当しない

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

### 2. その他の関連資料

医療従事者向け資料：なし

患者向け資料：なし

nihon  
medi+physics

---

 日本メジフィジックス株式会社

〒136-0075 東京都江東区新砂三丁目4番10号 TEL (03) 5634-7006 (代)

<https://www.nmp.co.jp/>