

# 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 2008 に準拠して作成

放射性医薬品 ・ 腎及び尿路疾患診断薬

## MAGシンチ®注

放射性医薬品基準メルカプトアセチルグリシルグリシルグリシンテクネチウム(<sup>99m</sup>Tc)注射液

MAGscinti® Injectable

剤形	注射剤
製剤の規制区分	処方せん医薬品 (注意－医師等の処方せんにより使用すること)
規格・含量	1 mL 中, メルカプトアセチルグリシルグリシルグリシンテクネチウム( <sup>99m</sup> Tc)として 370MBq (検定日時において)
一般名	和名:メルカプトアセチルグリシルグリシルグリシンテクネチウム( <sup>99m</sup> Tc)注射液 洋名:Technetium( <sup>99m</sup> Tc)Mercaptoacetylglycylglycylglycine Injection
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認年月日:1995年1月20日 承認事項一部変更承認年月日:2009年5月20日(規格及び試験方法の変更) 薬価基準収載年月日:1995年6月2日 発売年月日:1995年6月12日
開発・製造発売(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 〔 〕 FAX 〔 〕
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 2013 年 10 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。  
最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ <http://www.info.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

# IF利用の手引きの概要

～日本病院薬剤師会～

## 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会において新たなIF記載要領が策定された。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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は薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式】

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

### 【IFの作成】

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」（以下、「IF記載要領2008」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業の製本は必須ではない。

## [ I F の発行 ]

- ① 「 I F 記載要領2008」は、平成21年4月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「 I F 記載要領2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合は I F が改訂される。

### 3. I F の利用にあたって

「 I F 記載要領2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、 P D F ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関での I T 環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体の I F については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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」に従って作成・提供するが、 I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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薬剤師等自らが内容を充実させ、 I F 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、 I F が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、 I F の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。 I F は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、 I F があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2008年9月)

# 目 次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17
1. 開発の経緯		1. 警告内容とその理由	
2. 製品の治療（診断）学的・製剤学的特性		2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	
II. 名称に関する項目	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	
1. 販売名		4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	
2. 一般名		5. 慎重投与内容とその理由	
3. 構造式又は示性式		6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	
4. 分子式及び分子量		7. 相互作用	
5. 化学名（命名法）		8. 副作用	
6. 慣用名，別名，略号，記号番号		9. 高齢者への投与	
7. CAS登録番号		10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	
III. 有効成分に関する項目	5	11. 小児等への投与	
1. 物理化学的性質		12. 臨床検査結果に及ぼす影響	
2. 有効成分の各種条件下における安定性		13. 過量投与	
3. 有効成分の確認試験法		14. 適用上の注意	
4. 有効成分の定量法		15. その他の注意	
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	
1. 剤形		IX. 非臨床試験に関する項目	20
2. 製剤の組成		1. 薬理試験	
3. 注射剤の調製法		2. 毒性試験	
4. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意		X. 管理的事項に関する項目	21
5. 製剤の各種条件下における安定性		1. 規制区分	
6. 溶解後の安定性		2. 有効期間又は使用期限	
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）		3. 貯法・保存条件	
8. 生物学的試験法		4. 薬剤取扱い上の注意点	
9. 製剤中の有効成分の確認試験法		5. 承認条件等	
10. 製剤中の有効成分の定量法		6. 包装	
11. 力価		7. 容器の材質	
12. 混入する可能性のある夾雑物		8. 同一成分・同効薬	
13. 治療（診断）上注意が必要な容器に関する情報		9. 国際誕生年月日	
14. その他		10. 製造販売承認年月日及び承認番号	
V. 治療（診断）に関する項目	10	11. 薬価基準収載年月日	
1. 効能又は効果		12. 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	
2. 用法及び用量		13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	
3. 臨床成績		14. 再審査期間	
VI. 薬効薬理に関する項目	12	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群		16. 各種コード	
2. 薬理作用		17. 保険給付上の注意	
VII. 薬物動態に関する項目	13	XI. 文献	23
1. 血中濃度の推移・測定法		1. 引用文献	
2. 薬物速度論的パラメータ		2. その他の参考文献	
3. 吸収		XII. 参考資料	24
4. 分布		1. 主な外国での発売状況	
5. 代謝		2. 海外における臨床支援情報	
6. 排泄		XIII. 備考	25
7. 透析等による除去率		その他の関連資料	

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

これまで腎動態検査に用いられてきた放射性医薬品としては、放射性ヨウ素 ( $^{123}\text{I}$  又は  $^{131}\text{I}$ ) 標識のヨウ化ヒプル酸ナトリウム注射液 (以下,  $^{123}\text{I}$ -OIH,  $^{131}\text{I}$ -OIH) 並びにジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム ( $^{99\text{m}}\text{Tc}$ ) 注射液 (以下,  $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA) がある。

2-ヨウ化ヒプル酸ナトリウム (以下, OIH) は主に尿細管から排泄される薬剤であり, これを放射性ヨウ素 ( $^{123}\text{I}$  又は  $^{131}\text{I}$ ) で標識した場合, 腎/バックグラウンド比が高く良好な腎動態画像及び識別性の高いレノグラムが得られる。しかし,  $^{131}\text{I}$ -OIH は  $^{131}\text{I}$  の放出  $\gamma$  線エネルギーが高く核医学イメージングに適さないこと, また  $\beta$  線を放出し, 物理的半減期も長いために被曝線量が高くなることから, 投与量が制限され良好な画像が得られないという欠点を有する。一方, これまで用いられてきた  $^{123}\text{I}$ -OIH は,  $^{123}\text{I}$  の放出  $\gamma$  線エネルギーが核医学イメージングに適しているため良好な動態画像が得られるが,  $^{99\text{m}}\text{Tc}$  製剤と比較すると投与量が少なく, 腎血流情報を得るには必ずしも十分ではなかった。

$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA は  $^{99\text{m}}\text{Tc}$  の放出  $\gamma$  線エネルギーが核医学イメージングに適していること, 及び物理的半減期が短く大量投与が可能であることから良好な腎血流画像が得られる。しかし, 糸球体でろ過される薬剤であり, 主に尿細管からろ過される他剤に比べ腎摂取率が低い, 腎/バックグラウンド比が低い, 軽度の腎機能障害例においても腎の描出が悪くなる, またレノグラムが平坦化し, レノグラムの識別性が悪くなるという問題があった。このような背景から, OIH と同様の優れた体内動態を示し, かつ良好な血流画像も得られる腎・尿路機能の診断に適した  $^{99\text{m}}\text{Tc}$  標識製剤の開発が望まれていた。メルカプトアセチルグリシルグリシルグリシンテクネチウム ( $^{99\text{m}}\text{Tc}$ ) (以下,  $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -MAG3) は, この条件を満たす薬剤として Fritzberg <sup>1)</sup> らによって開発された製剤である。 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -MAG3 は主に尿細管から排泄され, OIH と類似した体内動態を示し, かつより良好な画像が得られることから, 腎機能診断用放射性医薬品としての有効性が示されている。

当社は, 院内での加熱などの標識操作や品質管理などの複雑な作業が不要で, 標識安定性の高い  $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -MAG3 の既調製注射液を開発し, 1995年1月に承認された。3201例の使用成績調査を実施し, 2004年3月に薬事法第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。その後, 規格及び試験方法の変更により, 2009年5月に一部変更承認を取得した。

## 2. 製品の治療 (診断) 学的・製剤学的特性

### 1. 良好な画質のシンチグラムが得られる <sup>2)</sup> ~ <sup>4)</sup>。

テクネチウム標識製剤は, 放出  $\gamma$  線エネルギー (141keV) が核医学イメージングに適しており, 良好な画質のシンチグラムが得られる。

### 2. 識別性の高いレノグラムが得られる <sup>2)</sup> ~ <sup>4)</sup>。

本剤は大部分が尿細管分泌により排出され, 識別性の高いレノグラムが得られる。

### 3. 腎・尿路疾患の診断に関して, 信頼性の高い情報及び所見が得られる <sup>1)</sup> ~ <sup>7)</sup>。

- ・腎動態シンチグラフィに適した薬物動態を示し, 腎血流, 腎実質機能, 尿路の通過状態及び腎の形態を非侵襲的に診断することができる。
- ・有効腎血漿流量 (ERPF) の測定により, 腎機能障害の程度や病態の変化を定量的に評価できるため, 腎疾患の重症度の診断や経過観察に有効である。

## 4. 既調製注射液なので、安全かつ取扱いが容易である。

本剤は、調製操作が不要なため細菌汚染がなく、術者の無用の被曝を防ぐことができる。

[類似薬との比較]

現在、腎機能の診断に用いられる放射性医薬品としては、 $^{131}\text{I}$ -OIH 及び  $^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA が承認されている。

		本剤	$^{131}\text{I}$ -OIH	$^{99\text{m}}\text{Tc}$ -DTPA
効能・効果		シンチグラフィ及びレノグラフィによる腎及び尿路疾患の診断	腎及び尿路疾患の診断	腎シンチグラフィによる腎疾患の診断
集積機序		腎血流量に比例して腎へ移行した後、主に尿細管における能動輸送により高率に尿中排泄される。	同左	腎血流量に比例して腎へ移行した後、糸球体ろ過により尿中排泄される。
レノグラム		軽度～高度の腎機能障害に対して、識別性の高いレノグラムが得られる。	レノグラムの識別性は $^{123}\text{I}$ -OIHと同等であるが、シンチレーションカメラを用いたレノグラムの作成が困難なため、レノグラム専用装置が必要である。	軽度の腎機能障害でもレノグラムが平坦化し、重症例との鑑別が困難となる。
動態画像	血流画像	大量投与が可能であるため血流画像は良好である。	得られない。	良好であるが本剤に比し、バックグラウンドが高い。
	経時画像	腎/バックグラウンド比が高く、情報密度の高い明瞭な画像が得られる。	良好な画像を得るのは困難である。	情報密度は高いが、腎/バックグラウンド比が低いため、軽度の腎機能障害でも不明瞭な経時画像となる。

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

MAGシンチ<sup>®</sup>注

#### (2) 洋名

MAGscinti<sup>®</sup> Injectable

#### (3) 名称の由来

Mercaptoacetylglcylglycylglycine をテクネチウム-99m(<sup>99m</sup>Tc) で標識した腎シンチグラフィ用注射剤であることより命名した。

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

メルカプトアセチルグリシルグリシルグリシンテクネチウム(<sup>99m</sup>Tc)注射液

#### (2) 洋名 (命名法)

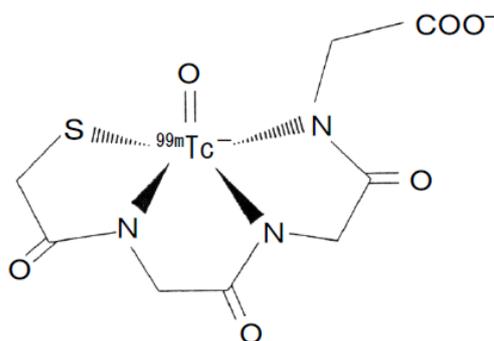
Technetium(<sup>99m</sup>Tc) Mercaptoacetylglcylglycylglycine Injection

#### (3) ステム

該当しない

### 3. 構造式又は示性式

推定構造<sup>1)</sup> :



### 4. 分子式及び分子量

分子量 : 263.27

### 5. 化学名 (命名法)

Technetate(2-)-<sup>99m</sup>Tc, [(mercapto-, kappa, S) acetylglcyl-, kappa, N-glycyl-, kappa, N-glycinato(-)-, kappa, N]oxo-, disodium, (SP-5-25)-(9 C I) (CA INDEX NAME)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

$^{99m}\text{Tc}$ -MAG3

7. CAS登録番号

CAS-125224-05-7

## III. 有効成分に関する項目

### 1. 物理化学的性質

- (1) 外観・性状
- (2) 溶解性
- (3) 吸湿性
- (4) 融点（分解点），沸点，凝固点
- (5) 酸塩基解離定数
- (6) 分配係数

(1)～(6)：放射性の標識化合物であり微量のため該当資料なし

### (7) その他の主な示性値

〔核物理学的特性〕

<sup>99m</sup>Tc として、

1. 物理的半減期：6.01 時間
2. 主γ線エネルギー：141keV（89.1%）
3. 減衰表

時間	222MBq 包装 MBq/バイアル	333MBq 包装 MBq/バイアル	555MBq 包装 MBq/バイアル	MBq/mL
9 : 00	313.7	470.5	784.2	522.8
10 : 00	279.5	419.3	698.8	465.9
11 : 00	249.1	373.7	622.8	415.2
<b>12 : 00</b>	<b>222.0</b>	<b>333.0</b>	<b>555.0</b>	<b>370.0</b>
13 : 00	197.8	296.8	494.6	329.7
14 : 00	176.3	264.5	440.8	293.9
15 : 00	157.1	235.7	392.8	261.9
16 : 00	140.0	210.0	350.1	233.4

### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

放射性の標識化合物であり微量のため該当資料なし

### 3. 有効成分の確認試験法

p. 7 〈IV. 製剤に関する項目〉－〈9. 製剤中の有効成分の確認試験法〉の項参照

### 4. 有効成分の定量法

p. 7 〈IV. 製剤に関する項目〉－〈10. 製剤中の有効成分の定量法〉の項参照

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別, 規格及び性状

区別：注射剤（溶液）

規格：1 mL 中, 370MBq（検定日時において）

ガラス製シリンジ型バイアル

性状：微黄色澄明の液

#### (2) 溶液及び溶解時の pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等

pH：7.0～10.5

浸透圧比：約 0.7（生理食塩液に対する比）

粘度, 比重, 安定な pH 域等：該当資料なし

#### (3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

特になし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

本剤は、水性の注射剤で、テクネチウム-99m をメルカプトアセチルグリシルグリシルグリシンテクネチウムの形で含む。

1 mL 中,

メルカプトアセチルグリシルグリシルグリシンテクネチウム ( <sup>99m</sup> Tc) として	
（検定日時において）	370MBq
メルカプトアセチルグリシルグリシルグリシン	0.15mg

#### (2) 添加物

1 mL 中, 無水塩化第一スズ 0.045mg, 日本薬局方アスコルビン酸 5 mg, 日本薬局方生理食塩液及び pH 調整剤 2 成分を含有する。

#### (3) 電解質の濃度

該当資料なし

#### (4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

#### (5) その他

特になし

### 3. 注射剤の調製法

該当しない

**4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意**

該当資料なし

**5. 製剤の各種条件下における安定性**

本剤は放射線遮へい用鉛容器に収納されるため、常時遮光されている。

**1. 長期保存試験による安定性**

本剤を室温で 32 時間保存して試験を行った結果、安定であることが確認された。

**2. 苛酷試験による安定性**

本剤を 60℃で 24 時間保存して試験を行った結果、本剤を苛酷な条件下で保存した場合には、pH は中性付近まで低下し、保存期間中に放射化学的異物として主に還元性テクネチウム ( $^{99m}\text{Tc}$ ) 及びテクネチウムアスコルビン酸 ( $^{99m}\text{Tc}$ ) が生成するものと考えられた。その他の試験項目については、60℃保存による変化は何も認められなかった。

**6. 溶解後の安定性**

該当しない

**7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）**

該当資料なし

**8. 生物学的試験法**

該当しない

**9. 製剤中の有効成分の確認試験法****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ガンマ線スペクトロメータによるスペクトルの測定法により試験を行うとき、0.141MeV にピークを認める。

**2. メルカプトアセチルグリシルグリシルグリシンテクネチウム ( $^{99m}\text{Tc}$ )**

アセトニトリル/0.9%塩化ナトリウム溶液/酢酸(100)混液(80:20:1)を展開溶媒として、薄層クロマトグラフ法により試験を行うとき、Rf 値が 0.55~0.85 の位置に放射能ピークを認める。なお、薄層板は薄層クロマトグラフ用セルロースを用いて調製する。

**10. 製剤中の有効成分の定量法**

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定量法により放射能を測定する。

**11. 力価**

該当しない

**12. 混入する可能性のある夾雑物**

特になし

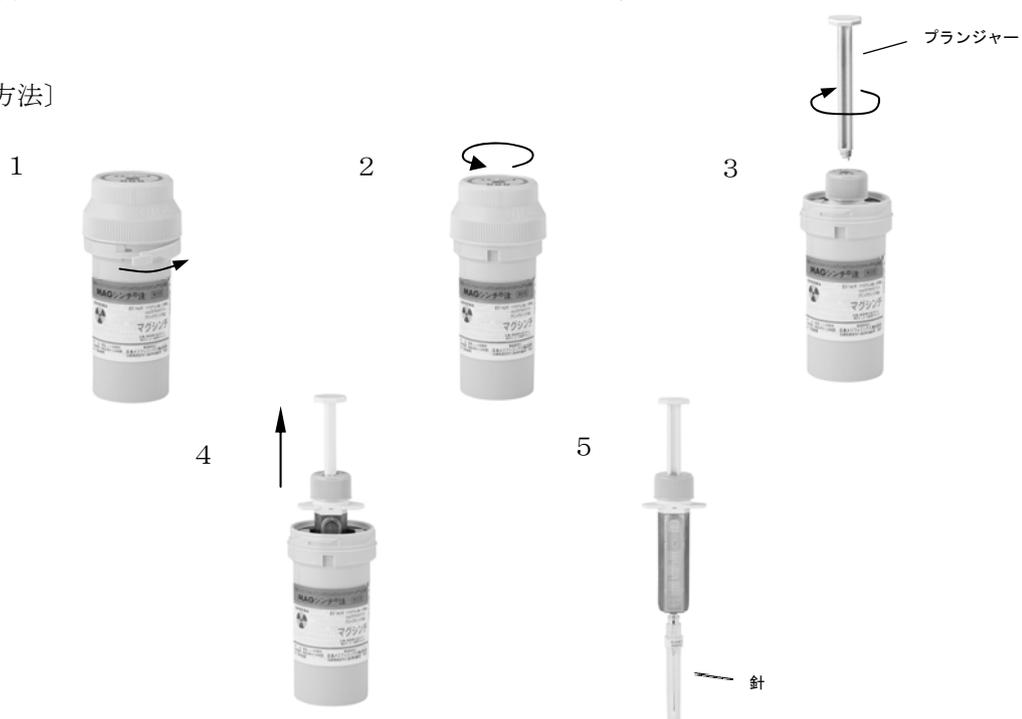
## 13. 治療（診断）上注意が必要な容器に関する情報\*

シリンジタイプの外観及び使用方法

〔内容〕



〔使用方法〕



1. コンテナのセイフティバンドを矢印の方向に引っ張って切り取る。  
**注意：セイフティバンドを上方向に引っ張らないで下さい！**
2. 上蓋を外す（反時計回りに回すと自然に外れます）。  
**注意：上蓋を上方に引っ張って外さないで下さい！**
3. プランジャーを取り付ける。
4. コンテナから取り出す（シールドキャップを持って取り出せます）。
5. 先端のゴムキャップを取り、針等（両刃針，ルーアーアダプタ，他）を取り付ける。
6. 患者に投与する。

## 〔取扱い上の注意〕

1. プランジャーをねじ込む前に、針等を取り付けしないで下さい。
2. 針等を取り付ける時に、プランジャーを押し込まないようにして下さい。
3. プランジャーは真っ直ぐに挿し込み、軽くねじ込めば取り付けられます。斜め方向に無理に押し込んだ場合、ガスケットが変形し薬液が漏れる恐れがありますので、ご注意ください。
4. シリンジ中にごくわずか気泡が含まれている場合があります。注射液を患者に投与してもこの気泡はシリンジ中に残り、患者に投与されることはありませんが、気泡の位置に注意しながら投与して下さい。

## 〔使用後の廃棄方法〕

1. 誤刺に注意して、針等を外す。
2. プランジャーは取り付け時と反対の方向（反時計方向）に回して取り外す。
3. シールドキャップを回して取り外し、シールドからシリンジを抜き取り廃棄する。

**14. その他**

特になし

## V. 治療（診断）に関する項目

### 1. 効能又は効果

シンチグラフィ及びレノグラフィによる腎及び尿路疾患の診断

### 2. 用法及び用量

通常、成人には 200～555MBq を静脈内に投与する。被検部に検出器を向け、投与直後から動態画像を得ると共に、データ処理装置にデータを収集し、画像上に關心領域を設定することによりレノグラムを得る。また、必要に応じて有効腎血流量又は有効腎血漿流量を測定する。

なお、投与量は、年齢、体重及び検査目的により適宜増減する。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ（2009 年 4 月以降承認品目）

該当しない

#### (2) 臨床効果

第 3 相臨床試験において、以下の腎・尿路疾患患者を対象に有効性が検討され、497 例中やや有効とされた 1 例を除く 496 例（99.8%）で本剤の有効性が示された<sup>4)</sup>。

糸球体腎炎、尿路通過障害（水腎症を含む）、腎・尿路結石、糖尿病性腎症、腎血管性高血圧症、腎腫瘍性病変（嚢胞を含む）、高血圧性腎症、ネフローゼ症候群、腎不全、移植腎、その他の腎・尿路疾患

その他、本剤の腎・尿路疾患診断における臨床の有効性について、以下のような知見が得られた。

(1) 本剤のレノグラムの  $T_{max}$  及び  $T_{1/2}$  の値はヨウ化ヒプル酸ナトリウム ( $^{123}I$ ) 注射液の指標と相関関係が認められた<sup>4)</sup>。

(2) 有効腎血漿流量などの腎機能指標の算出が可能であり、その値はヨウ化ヒプル酸ナトリウム ( $^{123}I$ ) 注射液の値と相関がみられた<sup>6)</sup>、<sup>7)</sup>。

(3) 本剤の腎摂取率はジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム ( $^{99m}Tc$ ) 注射液の約 3 倍であった<sup>8)</sup>。

(4) ヨウ化ヒプル酸ナトリウム ( $^{123}I$ ) 注射液及びジエチレントリアミン五酢酸テクネチウム ( $^{99m}Tc$ ) 注射液と有効性、所見の信頼性及び画質について比較を行った結果、本剤の有効性は両薬剤より優れており、本剤により信頼性の高い所見が得られ、画質に関しては、血流画像及び経時画像共に本剤の方が優れていた<sup>4)</sup>。

#### (3) 臨床薬理試験：忍容性試験<sup>2)</sup>

健常成人男子 3 名に対して、本剤を 370MBq 単回投与した結果、全例において自・他覚症状の異常はみられず、また本剤に起因すると考えられる臨床検査値の異常変動も認められなかった。

#### (4) 探索的試験：用量反応探索試験<sup>3)</sup>

腎・尿路疾患患者 97 例（男性 51 例、女性 46 例）に対して、本剤 92.5MBq、185MBq、370MBq、または 555MBq の 4 用量のいずれかを静脈内 1 回投与した。その結果、本剤の投与量は 370MBq を標準とする 185～555MBq の範囲が適当であり、検査の目的、患者の年齢及び体重等を考慮し、適宜増減することが適当であると考えられた。

注）本剤の承認されている用法・用量は 200～555MBq である。

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験<sup>4)</sup>

① <sup>123</sup>I-OIH との比較

腎・尿路疾患患者 150 例に対して本剤 377.4±95.9MBq, <sup>123</sup>I-OIH 39.0±12.3MBq（平均値±標準偏差）を投与し比較を行った結果, <sup>123</sup>I-OIH よりも良好な画像と, それに基づいた信頼性の高い情報が得られることが示された。

② <sup>99m</sup>Tc-DTPA との比較

腎・尿路疾患患者 151 例に対して本剤 377.4±95.9MBq, <sup>99m</sup>Tc-DTPA 424.0±165.3MBq（平均値±標準偏差）を投与し比較を行った結果, <sup>99m</sup>Tc-DTPA よりも腎/バックグラウンド比の高いシンチグラムと識別性の高いレノグラムが得られ, 本剤の高い有効性が認められた。

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

使用成績調査において, 3201 例中, ショックが 1 件 (0.03%) 報告された (再審査終了時)

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理学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（集積）部位・作用（集積）機序

本剤は静脈内投与後速やかに血中から消失し，体内で代謝を受けることなく，尿細管に能動的に高率に取り込まれ，尿中に排泄される<sup>2)</sup>。本剤の腎での摂取は有効腎血漿流量や有効腎血流量を反映する。したがって，本剤の腎・尿路における薬物動態を経時的に撮像し，また，腎における時間－放射能曲線（レノグラム）を解析することにより，腎血流，腎実質機能，尿路の通過状態及び腎の形態を非侵襲的に診断することができる<sup>2)～4)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

p. 14 〈VII. 薬物動態に関する項目〉－〈4. 分布〉－〈(5) その他組織への移行性〉の項参照

#### (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・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当しない

#### (2) 最高血中濃度到達時間

該当しない

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>2)</sup>

本剤を健常成人男子 3 名に 370MBq 静脈内投与し、体内動態を解析した（図 1 参照）。  
本剤は、静脈内投与後、急速に血中から消失し、血中放射能の%投与量は投与後 5 分で  $32.4 \pm 2.2\%$ （平均値±標準偏差）、10 分で  $20.3 \pm 2.0\%$ 、30 分で  $6.8 \pm 0.7\%$ であった。血中からの消失は 2 相性を示し、初期相の消失半減期は  $3.2 \pm 0.5$  分、後期相の消失半減期は  $18.6 \pm 4.8$  分であった。

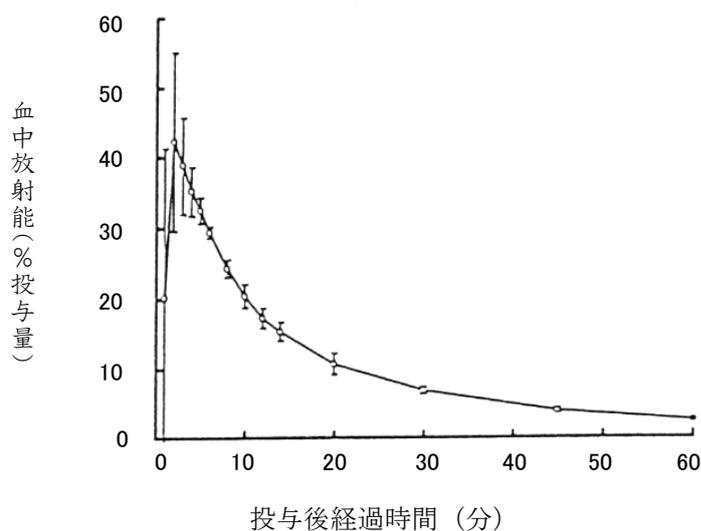


図 1 血中の放射能経時変化（3 例の平均値±標準偏差）

#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

#### (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) コンパートメントモデル

該当資料なし

## (2) 吸収速度定数

該当しない

## (3) バイオアベイラビリティ

該当しない

## (4) 消失速度定数

該当資料なし

## (5) クリアランス

P. 13 &lt;VII. 薬物動態に関する項目&gt;-&lt;1. 血中濃度の推移・測定法&gt;

-&lt;(3) 臨床試験で確認された血中濃度&gt;の項参照

## (6) 分布容積

該当資料なし

## (7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 3. 吸収

該当しない

## 4. 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<sup>2)</sup>

本剤を健常成人男子 3 名に 370MBq 静脈内投与し、主要臓器における放射能分布の経時変化を求めた (図 2 参照)。

腎における放射能分布は、投与後 30 分、90 分及び 3 時間でそれぞれ  $1.76 \pm 0.13\%$  (平均値 ± 標準偏差)、 $0.63 \pm 0.11\%$  及び  $0.25 \pm 0.04\%$  であり、投与後 30 分で既に十分低値を示していることから、本剤の大部分は投与後 30 分以内に排泄されることが示された。投与後 90 分～6 時間の全身像で、腎及び膀胱のほか、肝、胆のう及び腸管が描出された。しかし、肝への集積は投与後 30 分で  $1.19 \pm 0.30\%$  とわずかであった。また、胆のうが強く描出されたが、最大でも  $0.20\%$  (投与後 90 分及び 3 時間) と集積はわずかであることから、小さな臓器に放射能が

局在したために濃く描出されたものと考えられた。

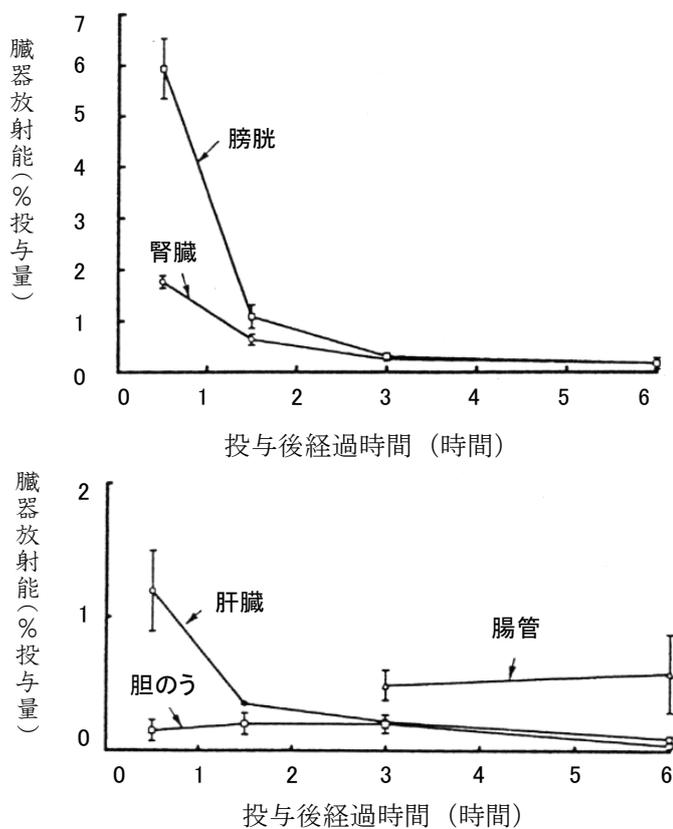


図2 主要臓器の放射能経時変化（3例の平均値±標準偏差）

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路<sup>2)</sup>

健常成人男子3例に本剤 370MBq を静注し、血清中及び尿中の放射能の存在形態を薄層クロマトグラフ法により検討した。

〈血中放射化学的成分〉

血中では、 $^{99m}\text{Tc}$ -MAG3、本剤の生成中間体と考えられる化合物でビスメルカプトアセチルグリシルグリシルグリシンテクネチウム ( $^{99m}\text{Tc}$ ) と推定される放射化学的成分(以下、 $^{99m}\text{Tc}$ (MAG3)<sub>2</sub>)及びアスコルビン酸テクネチウム ( $^{99m}\text{Tc}$ ) (以下、 $^{99m}\text{Tc}$ -AA) が認められた。これらの3種類の放射化学的成分のうち、 $^{99m}\text{Tc}$ -MAG3 以外の成分はいずれも本剤中にもともと含まれる放射化学的異物であった。

〈尿中放射化学的成分〉

尿中の放射化学的成分のほとんどは代謝を受けていない  $^{99m}\text{Tc}$ -MAG3 の未変化体であり、 $^{99m}\text{Tc}$ -MAG3 以外の成分はどの時点でもわずかであった。

以上のことから、 $^{99m}\text{Tc}$ -MAG3 は体内でほとんど代謝されることなく尿中へ排泄されるものと考えられた。

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

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比率

該当資料なし

## (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路<sup>2)</sup>

本剤を健常成人男子 3 名に 370MBq 静脈内投与し、尿中累積排泄率を求めた（図 3 参照）。尿中累積排泄率は、投与後 30 分で  $76.8 \pm 0.4\%$ （平均値±標準偏差）、90 分で  $91.7 \pm 0.1\%$ 、3 時間で  $95.9 \pm 0.2\%$ 、6 時間で  $97.1 \pm 1.0\%$  及び 24 時間で  $98.0 \pm 1.0\%$  であり、本剤は投与後 24 時間までには投与されたほぼ全量が尿中に排泄されることが示された。

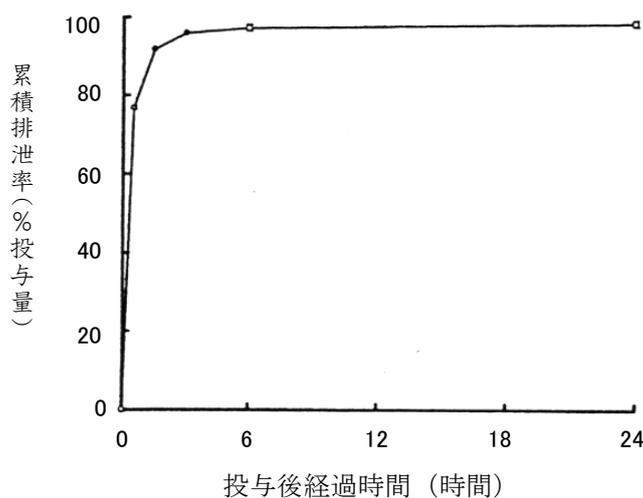


図 3 尿中累積放射能経時変化（3例の平均値±標準偏差）

## (2) 排泄率

前項〈(1)排泄部位及び経路〉を参照

## (3) 排泄速度

前項〈(1)排泄部位及び経路〉を参照

## 7. 透析等による除去率

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

特になし

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

特になし

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

特になし

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

特になし

### 5. 慎重投与内容とその理由

特になし

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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、投与量は最少限度にとどめること。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

特になし

#### (2) 併用注意とその理由

特になし

### 8. 副作用

#### (1) 副作用の概要

臨床試験（619例）において副作用及び臨床検査値の異常変動が認められた例はなかった。使用成績調査において、3201例中、ショックが1件（0.03%）報告された（再審査終了時）。

#### (2) 重大な副作用と初期症状

##### 重大な副作用

ショック：まれに（0.1%未満）ショック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適切な処置を行うこと。

#### (3) その他の副作用

特になし

**(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧**

副作用発現頻度：前項〈(1)副作用の概要〉を参照

臨床検査値異常：前項〈(1)副作用の概要〉を参照

**(5) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度**

該当資料なし

**(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法**

該当資料なし

**9. 高齢者への投与**

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、患者の状態を十分に観察しながら慎重に投与すること。

**10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与**

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び授乳中の婦人には、原則として投与しないことが望ましいが、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。

**11. 小児等への投与**

小児等に対する安全性は確立していない（現在までのところ、十分な臨床成績が得られていない）。

**12. 臨床検査結果に及ぼす影響**

該当資料なし

**13. 過量投与**

該当資料なし

**14. 適用上の注意**

膀胱部の被曝を軽減させるため、検査前後できるだけ患者に水分を摂取させ、排尿させること。

**15. その他の注意**

特になし

## 16. その他

〔吸収線量〕

(MIRD法により算出)

臓器	吸収線量 (mGy/MBq)
膀胱	0.029
腎臓	0.0028
肝臓	0.00060
胆のう	0.0017
脾臓	0.00047
小腸	0.0021
大腸上部	0.0030
大腸下部	0.0031
赤色骨髄	0.00085
卵巣	0.0020
精巣	0.0010
全身	0.00063

(0.5, 3及び6時間後に排尿した場合)

## 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」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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

雌雄ラット及び雄ビーグル犬を用いて単回投与毒性試験を実施した。ラット及びビーグル犬にメルカプトアセチルグリシルグリシルグリシン 11mg/kg体重(臨床予定投与量の2900倍以上)を静注後、14日間観察したが、ラット及びビーグル犬共に被験物質の影響は認められなかった。

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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

処方せん医薬品 注意－医師等の処方せんにより使用すること

### 2. 有効期間又は使用期限

有効期間：製造日時より 24 時間

### 3. 貯法・保存条件

室温，遮光保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱いについて

該当しない

#### (2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

該当しない

### 5. 承認条件等

特になし

### 6. 包装

シリンジタイプ：222MBq, 333MBq, 555MBq

### 7. 容器の材質

シリンジ型バイアル：ガラス，放射線遮へい容器：鉛

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：テクネ MAG<sub>3</sub> 注，テクネ MAG<sub>3</sub> キット

同 効 薬：ヨウ化ヒプル酸ナトリウム (<sup>131</sup>I) 注射液

### 9. 国際誕生年月日

1990 年 6 月 15 日

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：1995 年 1 月 20 日

承認番号：20700AMZ00029000

承認事項一部変更承認年月日：2009 年 5 月 20 日（規格及び試験方法の変更）

### 11. 薬価基準収載年月日

1995 年 6 月 2 日（1995 年 6 月 2 日付厚生省告示第 117 号）

## 12. 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

なし

## 13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

2004年3月23日付厚生労働省発薬食第0323002号-62

薬事法第14条第2項各号(承認拒否事由)のいずれにも該当しない

## 14. 再審査期間

1995年1月20日～2000年1月18日(終了)

## 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

該当しない

## 16. 各種コード

販売名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準収載 医薬品コード	レセプト電算コード
MAG シンチ <sup>®</sup> 注 222MBq	1 0 9 2 9 5 0 0 1	4 3 0 0 4 4 5 A 4 0 2 2	6 4 0 4 0 7 0 3 2
MAG シンチ <sup>®</sup> 注 333MBq	1 1 4 3 7 4 4 0 1	4 3 0 0 4 4 5 A 5 0 2 9	6 4 0 4 0 7 0 3 3
MAG シンチ <sup>®</sup> 注 555MBq	1 0 9 2 9 6 7 0 1	4 3 0 0 4 4 5 A 6 0 2 5	6 4 0 4 0 7 0 3 4

## 17. 保険給付上の注意

特になし

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) Fritzberg AR, et al : J Nucl Med **27** : 111-116, 1986
- 2) 池窪勝治, 他 : 核医学 **30** : 507-516, 1993
- 3) 鳥塚莞爾, 他 : 核医学 **30** : 1379-1392, 1993
- 4) 鳥塚莞爾, 他 : 核医学 **31** : 183-198, 1994
- 5) Freeman LM : Nuclear Medicine Annual 1991, Raven Press, New York, 1991 : pp. 1-35
- 6) 佐藤始広, 他 : 核医学 **31** : 75-84, 1994
- 7) 河 相吉, 他 : 核医学 **31** : 175-181, 1994
- 8) 井上優介, 他 : Clin Nucl Med **19** : 1049-1054, 1994

### 2. その他の参考文献

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

既調製の注射剤としては発売されていないが、用時調製用のキットとしてスイス、スウェーデン、アメリカ、フランス、ドイツ、イギリス、オランダなど世界 51 ヶ所の国や地域で承認されている。

(2000 年 1 月現在)

### 2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報 (FDA)

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米 FDA 分類とは異なる。

#### 【使用上の注意】

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び授乳中の婦人には、原則として投与しないことが望ましいが、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。

	分類
FDA : Pregnancy Category	C (2005 年 4 月)

参考：分類の概要

#### FDA : Pregnancy Category

C : Animal reproduction studies have not been conducted with technetium Tc 99m mertiatide. It is also not known whether this drug can cause fetal harm when administered to a pregnant woman or can affect reproduction capacity. Technetium Tc 99m mertiatide should be given to a pregnant woman only if clearly needed.

小児に関する記載

本邦における使用上の注意「小児等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米国の添付文書とは異なる。

#### 【使用上の注意】

小児等に対する安全性は確立していない（現在までのところ、十分な臨床成績が得られていない）。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2005 年 4 月)	<p>Pediatric Use</p> <p>Safety and effectiveness in pediatric patients under the age of 30 days have not been established.</p> <p>DOSAGE AND ADMINISTRATION</p> <p>In pediatric patients the recommended dose range is 2.6 MBq/kg (70 <math>\mu</math>Ci/kg) to 5.2 MBq/kg (140 <math>\mu</math>Ci/kg) with a minimum dose of 37 MBq (1 mCi).</p>

## XIII. 備考

その他の関連資料

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)

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