

|            |                  |
|------------|------------------|
| 日本標準商品分類番号 |                  |
| 874300     |                  |
| 承認番号       | 21700AMZ00697000 |
| 保険適用       | 2005年9月          |
| 販売開始       | 2005年8月          |
| 再審査結果      | 2015年6月          |
| 効能追加*      | 2018年2月          |

貯法：室温，遮光保存

有効期間\*\*：放射能が74MBqとなるまで，放射能減衰表参照  
（有効期間をラベルに記載）

放射性医薬品・悪性腫瘍診断薬，虚血性心疾患診断薬，てんかん診断薬

処方箋医薬品<sup>(注)</sup>

# FDGスキャン<sup>®</sup>注

放射性医薬品基準フルデオキシグルコース (<sup>18</sup>F) 注射液

**原則禁忌（次の患者には投与しないことを原則とするが，特に必要とする場合には慎重に投与すること）**

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人〔動物試験において胎児移行性が報告されている<sup>1)</sup>。〕

## 【組成・性状】\*\*

本剤は，水性の注射剤で，フッ素-18をフルデオキシグルコースの形で含む。

|  |                                    |
|--|------------------------------------|
| 1 mL中  |                                    |
| フルデオキシグルコース ( <sup>18</sup> F)<br>(検定日時において) | 92.5MBq                            |
| 添加物  | 日本薬局方D-マンニトール 1.82mg<br>日本薬局方生理食塩液 |
| 外観   | 無色～微黄色澄明の液                         |
| pH   | 5.0～7.5                            |
| 浸透圧比   | 約1（生理食塩液に対する比）                     |

## 【効能又は効果】

### 1. 悪性腫瘍の診断

- (1) 肺癌，乳癌（他の検査，画像診断により癌の存在を疑うが，病理診断により確定診断が得られない場合，あるいは，他の検査，画像診断により病期診断，転移・再発の診断が確定できない場合）の診断
- (2) 大腸癌，頭頸部癌（他の検査，画像診断により病期診断，転移・再発の診断が確定できない場合）の診断
- (3) 脳腫瘍（他の検査，画像診断により転移・再発の診断が確定できない場合）の診断
- (4) 膀胱癌（他の検査，画像診断により癌の存在を疑うが，病理診断により確定診断の得られない場合）の診断
- (5) 悪性リンパ腫，悪性黒色腫（他の検査，画像診断により病期診断，転移・再発の診断が確定できない場合）の診断
- (6) 原発不明癌（リンパ節生検，CT等で転移巣が疑われ，かつ，腫瘍マーカーが高値を示す等，悪性腫瘍の存在を疑うが，原発巣の不明な場合）の診断

2. 虚血性心疾患（左室機能が低下している虚血性心疾患による心不全患者で，心筋組織のバイアビリテリ診断が必要とされ，かつ，通常の心筋血流シンチグラフィで判定困難な場合）の診断
3. 難治性部分てんかんで外科切除が必要とされる場合の脳グルコース代謝異常領域の診断
4. 大型血管炎の診断における炎症部位の可視化\*

## 【用法及び用量】\*\*

通常，成人には本剤1バイアルを静脈内に投与し撮像する。投与量(放射能)は，年齢，体重により適宜増減するが，最小74MBq，最大370MBqまでとする。

## 【使用上の注意】

### 1. 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，投与量は最少限度にとどめること。

### 2. 相互作用

併用注意（併用に注意すること）

| 薬剤名等            | 措置方法                      | 危険因子  |
|-----------------|---------------------------|---|
| 膵臓ホルモン<br>インスリン | 本剤投与前4時間以内のインスリンの投与は避けること | 本剤の腫瘍への集積とバックグラウンドとのコントラストが低下する可能性がある <sup>2)</sup> |

### 3. 副作用

承認時及び製造販売後の臨床試験の合計903例中117例(13.0%)に副作用(臨床検査値の異常を含む)が認められた。主な副作用は，嘔気6件(0.7%)，そう痒感4件(0.4%)であった。また，主な臨床検査値の異常は，尿潜血陽性17件(1.9%)，尿蛋白陽性15件(1.7%)，尿糖陽性12件(1.3%)，血中カリウム増加8件(0.9%)，リンパ球百分率減少8件(0.9%)，血中尿素窒素増加7件(0.8%)，血圧上昇7件(0.8%)等であった(再審査終了時)。

使用成績調査及び特定使用成績調査の合計1291例中2例(0.2%)に副作用が認められた(再審査終了時)。

### その他の副作用

|     | 1～2%未満             | 0.1～1%未満  | 頻度不明*      |
|-----|--------------------|---|------------|
| 血液  | —                  | 好中球百分率増加, リンパ球百分率減少                                 | —          |
| 腎臓  | 尿蛋白陽性, 尿潜血陽性, 尿糖陽性 | 血中尿素窒素増加  | —          |
| 肝臓  | —                  | 血中ビリルビン増加   | —          |
| 皮膚  | —                  | そう痒感, 蕁麻疹   | 発疹, 紅斑, 発赤 |
| 消化器 | —                  | 嘔気, 嘔吐  | —          |
| その他 | —                  | 血圧上昇, 血圧低下, 気分不良, 発熱, 血中カリウム増加, 血中カリウム減少, 血中アルブミン減少 | —          |

頻度は、承認時及び製造販売後の臨床試験の集計結果から算出した。

※自発報告につき頻度不明

#### 4. 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。

#### 5. 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には原則として投与しないこと。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。なお、授乳婦に投与した場合、24時間授乳を中止し投与後12時間は乳幼児との密接な接触を避けるよう指導すること。

#### 6. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(十分な臨床経験が得られていない)。

#### 7. 適用上の注意\*\*

(1) 投与前：本剤の集積は血糖値の影響を受ける可能性があるため、本剤投与前4時間以上は絶食し、糖尿病患者では血糖をコントロールするなど、本剤投与時には適切に血糖値を安定化させること。

心筋バイアビリティ診断において絶食する場合、健常部心筋への本剤の集積が抑制されない例があり、虚血心筋(糖代謝が亢進している)との鑑別に注意を要することがある。

なお、血糖値200mg/dL以上では、本剤の患部への集積の低下により偽陰性所見を呈する可能性が高いため、投与しないことが望ましい。

(2) 投与前：本剤は複数の包装単位を有する製剤である

ことから、本剤の取り違い防止のため、投与にあたっては本剤の製剤ラベルの表示を確認し、意図した患者へ確実に投与すること。

- (3) 投与前後：本剤の生理的集積の増加を避けるため、本剤投与前から撮像前は安静にして、激しい運動等は行わないこと。
- (4) 撮像前後：膀胱部の被曝を軽減させるため及び骨盤部読影の妨げとなる膀胱の描出を避けるため、撮像前後にできるだけ排尿させること。
- (5) 撮像時：撮像開始時間は検査目的に応じて設定すること。連続的な動態イメージングを行う場合は本剤投与直後より、静止画像を得る場合は本剤投与後30～40分以降に撮像する。
- (6) 診断時：悪性腫瘍の診断において、本剤は炎症等に集積し偽陽性所見を呈する可能性があるため、注意すること<sup>3,4)</sup>。
- (7) 診断時：悪性黒色腫の診断において、所属リンパ節転移に対する本剤の感度は低いため、所属リンパ節転移の見落としに注意すること。
- (8) 診断時：悪性腫瘍の診断において、微小な腫瘍を検出できない可能性があるため、注意すること。
- (9) 診断時：本剤の生理的集積及び病変部位の解剖学的位置を正確に把握するためには、他の画像検査所見を参考にすること。
- (10) 診断時：確定診断が必要な場合、生検等を実施することが望ましい。

#### 8. その他の注意

- (1) (社)日本アイソトープ協会医学・薬学部会放射性医薬品安全性小委員会の「放射性医薬品副作用事例調査報告」において、頭痛、悪寒、発疹、そう痒感、胸やけ(頻度不明)があらわれることが報告されている。また、日本核医学会放射性医薬品等適正使用評価委員会の「放射性医薬品の適正使用におけるガイドラインの作成」において、まれに血管迷走神経反応(顔面蒼白、悪心、息切れ)、アレルギー反応(発疹、蕁麻疹)があらわれることが報告されている<sup>5-7)</sup>。
- (2) 本剤の使用に際しての注意
  - ① 医療法その他の放射線防護に関する法令を遵守すること。
  - ② 特に以下の事項に留意すること。
    - ・医療法施行規則に基づく陽電子断層撮影診療用放射性同位元素の届出を行うこと。
    - ・他の診療用放射性同位元素と同様に、記録を作成し保存すること。
  - ③ その他、関連する告示、通知等の規定に従い、適正に使用すること。

#### 【薬物動態】

##### 1. 分布

本剤は血中から速やかに消失して主に脳へ分布し、その分布率は投与量の約25%(25%ID)、単位重量(g)あたりで約0.015

%ID/gであった。心臓への分布は被験者ごとに傾向が異なり、最も多く分布した例では約5%ID、単位重量(g)あたりで約0.014%ID/gであった。肺、肝臓、腎臓、脾臓、腸管、精巣及び全身筋肉への放射能の滞留はほとんどみられなかった。

## 2. 代謝・排泄

尿中放射能累積排泄率は経時的に増加し、投与後6時間で約32%IDであった。主たる排泄経路は腎・尿路系であることが示された。

代謝について、本剤は血漿中でほとんど代謝されずに存在し、未変化体のまま尿中に排泄されることが示された。

## 【臨床成績】

[参考情報] (公表論文を集計した成績である)

〈悪性腫瘍〉

手術適性を検討する非小細胞肺癌患者での所属リンパ節転移診断において、CTに対して、CTにFDG-PETを加えた場合(以下、CT+FDG)の診断能について2試験の成績を合計した。感度はCT 65.8%、CT+FDG 92.1%、特異度はCT 72.4%、CT+FDG 86.7%であり、CTに対するFDG-PETの上乗せ効果が認められた<sup>8,9)</sup>。また、CTで悪性・良性の鑑別診断が困難な肺結節を有する患者におけるFDG-PETの診断能について2試験の成績を合計した。FDG-PETの感度は96.2%、特異度は75.6%であった<sup>10,11)</sup>。

また、FDG-PETの診断目的ごとの診断能について、肺癌、乳癌、大腸癌、頭頸部癌、脳腫瘍、膵癌、悪性リンパ腫、原発不明癌及び悪性黒色腫を評価した84試験におけるFDG-PETの試験成績を以下に示す<sup>12)</sup>。

| 癌種   | 診断目的                  | 感度                 | 特異度                  |
|------|-----------------------|--------------------|----------------------|
| 肺癌   | 悪性・良性<br>鑑別診断         | 92.0%<br>(310/337) | 67.4%<br>(95/141)    |
|      | 所属リンパ節<br>転移診断        | 78.9%<br>(296/375) | 89.4%<br>(693/775)   |
|      | 遠隔転移<br>診断*           | 93.0%<br>(93/100)  | 94.3%<br>(199/211)   |
|      | 転移・再発<br>診断*          | 97.8%<br>(88/90)   | 78.0%<br>(32/41)     |
| 乳癌   | 悪性・良性<br>鑑別診断         | 76.0%<br>(168/221) | 87.7%<br>(71/81)     |
|      | 腋窩リンパ節<br>転移診断        | 75.6%<br>(344/455) | 87.2%<br>(565/648)   |
|      | 遠隔転移・<br>再発診断*        | 92.6%<br>(189/204) | 89.4%<br>(161/180)   |
| 大腸癌  | 遠隔転移・<br>再発診断*        | 95.1%<br>(293/308) | 90.3%<br>(130/144)   |
| 頭頸部癌 | 頸部リンパ節<br>転移診断        | 87.7%<br>(193/220) | 93.4%<br>(1248/1336) |
|      | 残存腫瘍・<br>再発診断         | 96.8%<br>(91/94)   | 80.3%<br>(122/152)   |
|      | 遠隔転移又<br>は重複癌の<br>検出* | 癌検出率 7.3% (6/82)   |                      |
| 脳腫瘍  | 再発診断                  | 79.3%<br>(69/87)   | 82.7%<br>(62/75)     |
| 膵癌   | 悪性・良性<br>鑑別診断         | 86.4%<br>(184/213) | 85.2%<br>(115/135)   |

| 癌種     | 診断目的           | 感度                  | 特異度                  |
|--------|----------------|---------------------|----------------------|
| 悪性リンパ腫 | 病期診断           | 93.8%<br>(480/512)  | 99.6%<br>(2481/2491) |
|        | 骨髄浸潤<br>診断     | 82.1%<br>(32/39)    | 93.3%<br>(83/89)     |
|        | 残存腫瘍・<br>再発診断  | 77.4%<br>(48/62)    | 89.5%<br>(179/200)   |
| 原発不明癌  | 原発巣検出          | 癌検出率 25.8% (42/163) |                      |
| 悪性黒色腫  | 所属リンパ節<br>転移診断 | 9.4%<br>(3/32)      | 94.4%<br>(67/71)     |
|        | 遠隔転移・<br>再発診断* | 90.9%<br>(251/276)  | 71.9%<br>(141/196)   |

※：転移性肝癌を含む

〈虚血性心疾患〉<sup>12)</sup>

冠動脈疾患及び左室機能低下を示す患者を対象とした14試験におけるFDG-PETの心筋バイアピリティ診断能は感度89.9% (726/808)、特異度64.2% (512/797)であった。

〈部分てんかん〉<sup>12)</sup>

外科的治療が考慮される部分てんかん患者を対象とした20試験を評価した。全ての試験においてFDG-PETは発作間欠期に実施されていた。術後の発作予後良好例のうち、FDG-PETで示された焦点部位がてんかん焦点の手術部位と一致する例数の割合を一致率として評価した。その結果、FDG-PETの一致率は73.4% (281/383)であった。MRIで異常所見が認められない例において、FDG-PETの一致率は71.1% (32/45)であった。また、側頭葉てんかんにおけるFDG-PETの一致率は、74.4% (169/227)であった。なお、側頭葉てんかんにおける発作時脳血流検査の一致率は、75.8% (138/182)であった。

## 【薬効薬理】

〈集積機序〉

腫瘍細胞においては、グルコーストランスポーターの発現による糖取り込み能の増加、解糖系の律速酵素であるヘキソキナーゼ活性の亢進並びに糖新生系の酵素であるグルコース-6-ホスファターゼ活性の低下によって、糖代謝が亢進している。

心筋においては、虚血状態に陥った場合、グルコーストランスポーターの増加による糖取り込み能の増加及び解糖系の律速酵素であるヘキソキナーゼ活性亢進により、糖代謝が亢進している。

てんかんの脳においては、焦点および発作に関係する部位の神経細胞の活動が増加している場合に糖代謝が亢進する一方、神経細胞の活動が減少している場合には糖代謝が低下する。

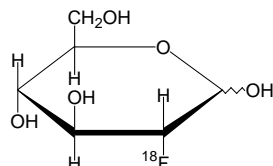
本剤は、グルコースと同様にグルコーストランスポーターにより細胞に取り込まれ、ヘキソキナーゼによりリン酸化を受けるが、グルコースと異なり解糖系の酵素であるホスホグルコースイソメラーゼによるフルクトースへの異性化反応を受けないことから、リン酸化体として細胞内に滞留する。したがって、その滞留した<sup>18</sup>F由来のポジトロンを核医学検査装置で追跡することにより、腫瘍細胞の診断、虚血性心疾患における心筋バイアピリティの診断、及びてんかん焦点の診断が可能となる。

【有効成分に関する理化学的知見】

【吸収線量】

1. フルデオキシグルコース (<sup>18</sup>F)

構造式：



2. 放射性核種の特長 (<sup>18</sup>Fとして)

物理的半減期：109.8分

主γ線エネルギー：0.511MeV (193.4%)

放射能減衰表 (MBq)

| 検定時間から<br>(分)             | 111MBq<br>包装 | 148MBq<br>包装 | 185MBq<br>包装 |
|---------------------------|--------------|--------------|--------------|
| -110                      | 222.3        | 296.4        | 370.5        |
| -100                      | 208.7        | 278.2        | 347.8        |
| -90                       | 195.9        | 261.2        | 326.5        |
| -80                       | 183.9        | 245.2        | 306.6        |
| -70                       | 172.7        | 230.2        | 287.8        |
| -60                       | 162.1        | 216.2        | 270.2        |
| -50                       | 152.2        | 202.9        | 253.7        |
| -40                       | 142.9        | 190.5        | 238.1        |
| -30                       | 134.1        | 178.9        | 223.6        |
| -20                       | 125.9        | 167.9        | 209.9        |
| -10                       | 118.2        | 157.6        | 197.1        |
| (検定時間 <sup>注</sup> )<br>0 | 111.0        | 148.0        | 185.0        |
| 10                        | 104.2        | 138.9        | 173.7        |
| 20                        | 97.8         | 130.4        | 163.1        |
| 30                        | 91.8         | 122.5        | 153.1        |
| 40                        | 86.2         | 115.0        | 143.7        |
| 50                        | 81.0         | 107.9        | 134.9        |
| 60                        | 76.0         | 101.3        | 126.7        |
| 64                        | 74.1         | 98.8         | 123.5        |
| 70                        |              | 95.1         | 118.9        |
| 80                        |              | 89.3         | 111.6        |
| 90                        |              | 83.9         | 104.8        |
| 100                       |              | 78.7         | 98.4         |
| 109                       |              | 74.4         | 93.0         |
| 110                       |              |              | 92.4         |
| 120                       |              |              | 86.7         |
| 130                       |              |              | 81.4         |
| 140                       |              |              | 76.4         |
| 145                       |              |              | 74.1         |

注) 検定時間：規格単位を定める時間

(MIRD法により算出)

|       |  | 吸収線量 (mGy/185MBq) |
|-------|--|-------------------|
| 脳     |  | 19.0              |
| 心臓    |  | 8.3               |
| 肺     |  | 2.0               |
| 肝臓    |  | 3.7               |
| 脾臓    |  | 2.6               |
| 小腸    |  | 1.6               |
| 大腸上部壁 |  | 1.6               |
| 大腸下部壁 |  | 1.9               |
| 腎臓    |  | 4.4               |
| 赤色骨髄  |  | 1.7               |
| 甲状腺   |  | 1.6               |
| 精巣    |  | 1.5               |
| 卵巣    |  | 1.9               |
| 膀胱壁   |  | 19.0              |
| 全身    |  | 1.9               |

(2時間ごとに排尿した場合)

【包装】

111MBq (1.2mL) 1バイアル, 148MBq (1.6mL) 1バイアル,  
185MBq (2mL) 1バイアル

【主要文献及び文献請求先】

<主要文献>

- 1) Sakuragawa N, et al : Nucl Med Biol **15** : 645-650, 1988
- 2) Minn H, et al : J Comput Assist Tomogr **17** : 115-123, 1993
- 3) 窪田和雄, 他 : 臨床医のためのクリニカルPET : 株式会社寺田国際事務所/先端医療技術研究所 (東京) p102, 2001
- 4) 織内昇 : 画像診断 **23** : 1142-1150, 2003
- 5) (社)日本アイソトープ協会医学・薬学部会放射性医薬品安全性小委員会 : 核医学 **32** : 605-614, 1995
- 6) (社)日本アイソトープ協会医学・薬学部会放射性医薬品安全性小委員会 : 核医学 **42** : 33-45, 2005
- 7) 日本核医学会放射性医薬品等適正使用評価委員会 : 核医学 **41(2)** : 1-58, 2004
- 8) Pieterman RM, et al : N Engl J Med **343**:254-261, 2000
- 9) Marom EM, et al : Radiology **212**:803-809, 1999
- 10) Lowe VJ, et al : J Clin Oncol **16**:1075-1084, 1998
- 11) Gupta NC, et al : J Nucl Med **37**:943-948, 1996
- 12) 申請資料概要, 2005

<文献請求先>

日本メジフィジックス株式会社 営業業務部  
〒661-0976 兵庫県尼崎市潮江1丁目2番6号  
0120-07-6941 (フリーダイヤル)

製造販売元

日本メジフィジックス株式会社  
東京都江東区新砂3丁目4番10号