

貯 法：室温保存
有効期間：製造日時から30時間

承認番号	20600AMZ00036000
販売開始	1994年5月

放射性医薬品／局所脳血流診断薬
放射性医薬品基準 [N,N'-エチレンジ-L-システイネート (3-)]
オキソテクネチウム (^{99m}Tc), ジエチルエステル注射液
処方箋医薬品^{注)}

ニューロライト®注射液 第一

Neurolite® Injection Daiichi

注) 注意 - 医師等の処方箋により使用すること

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ニューロライト注射液 第一		
	1シリンジ中	2.0mL	3.0mL
有効成分	[N,N'-エチレンジ-L-システイネート (3-)] オキソテクネチウム (^{99m} Tc), ジエチルエステル 放射能として (検定日時)	400MBq	600MBq
	N,N'- (1,2-エチレン) ビス-L-システインジエチルエステル二塩酸塩として	0.20mg	0.30mg
添加剤	塩化ズ (II) 二水和物	0.016mg	0.024mg
	エデト酸ナトリウム水和物	0.08mg	0.12mg
	D-マンニトール	5.3mg	8.0mg
	チオ硫酸ナトリウム水和物	6.7mg	10.0mg
	ベンジルアルコール	18.0μL	27.0μL
	リン酸水素ナトリウム水和物	3.656mg	5.484mg
	リン酸二水素ナトリウム二水和物	0.347mg	0.520mg
	生理食塩液	1.3mL	2.0mL
	塩酸	8.9nL	13.3nL

3.2 製剤の性状

販売名	ニューロライト注射液 第一
外観	無色澄明の液
pH	6.5~7.5
浸透圧比	約1 (生理食塩液に対する比)

4. 効能又は効果

局所脳血流シンチグラフィ

6. 用法及び用量

通常、成人には400~800MBqを静脈内に投与し、投与5分以降より被検部にガンマカメラ等の検出部を向け撮像もしくはデータを収録し、脳血流シンチグラムを得る。

なお、投与量は、年齢、体重および検査方法により適宜増減する。

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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

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。

9.7 小児等

9.7.1 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.7.2 低出生体重児、新生児に使用する場合には十分注意すること。外国において、ベンジルアルコールの静脈内大量投与 (99~234mg/kg) により、中毒症状 (あえぎ呼吸、アシドーシス、痙攣等) が低出生体重児に発現したとの報告がある。本剤は添加剤としてベンジルアルコールを含有している。

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。

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適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック (頻度不明)

11.2 その他の副作用

	頻度不明
過敏症	紅斑、蕁麻疹、そう痒感、発疹
消化器	嘔気、嘔吐
その他	しびれ、発熱

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 両頭針を取りつける際、プランジャーロッドを押さないようにすること。

14.1.2 シリンジ中にごくわずかに気泡が含まれている場合がある。注射液を投与してもこの気泡は通常シリンジ内に残るが、誤って投与することのないよう気泡の位置に注意しながら投与すること。

16. 薬物動態

16.3 分布

16.3.1 健常人を対象とした臨床試験では、[N,N'-エチレンジ-L-システイネート (3-)] オキソテクネチウム (^{99m}Tc), ジエチルエステル (^{99m}Tc-ECD) の脳への集積は投与後直ちに始まり、投与20~40秒後に最大となり、その後、極めてゆっくりとwash-outされた。投与後5分で投与量の5.4±0.5%、投与後65分で投与量の5.0±0.3%が脳実質に保持された。また、肺及び肝臓への集積は、投与後5分でそれぞれ投与量の7.5±1.7%、7.1±1.1%であったが、消失は迅速であり、投与後65分にはそれぞれ投与量の2.2±0.5%、2.4±0.6%へ速やかに低下した¹⁾。

16.3.2 吸収線量

MIRD法により計算した吸収線量は次のとおりである¹⁾。

臓器	吸収線量 (mGy/MBq)		臓器	吸収線量 (mGy/MBq)	
	2.5時間後 排尿	4.5時間後 排尿		2.5時間後 排尿	4.5時間後 排尿
脳	0.0051	0.0051	大腸上部	0.0068	0.0073
肺	0.0015	0.0015	大腸下部	0.011	0.012
心臓	0.0043	0.0043	膀胱壁	0.073	0.11
肝臓	0.0016	0.0016	卵巣	0.0049	0.0062
脾臓	0.0013	0.0013	精巣	0.0051	0.0062
腎臓	0.0032	0.0035	全身	0.0010	0.0010
小腸	0.0051	0.0057			

16.5 排泄

^{99m}Tc-ECDの主要排泄経路は腎-尿路系であり、投与後90分までに投与量の60.2±7.3%、投与後24時間までに投与量の88.5±10.3%が尿中へ排泄された¹⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内第Ⅲ相臨床試験

脳血管障害及び脳機能障害患者（脳梗塞、一過性脳虚血発作、脳内出血、クモ膜下出血、アルツハイマー型痴呆、てんかん等）521例を対象とした第Ⅲ相臨床試験の結果、有効性解析症例510例中486例（95.3%）において臨床診断に有効な情報が得られ、145例（28.4%）が極めて有用、299例（58.6%）が有用と評価された²⁾。

521例中、副作用は認められなかった。

18. 薬効薬理

18.1 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。

18.2 集積機序

中性、脂溶性の^{99m}Tc-ECDは、容易に血液脳関門を透過し、局所脳血流に比例して脳実質に取り込まれる³⁾。脳細胞ではサイトゾール分画に70%以上が分布している。アカゲザルの脳組織を用いたインビトロの検討では、^{99m}Tc-ECDが脳組織中で水溶性の単一なモノアシド-モノエステル体に迅速に加水分解され、この分解物は血液脳関門を透過しないことが確認されている。また、アカゲザルに^{99m}Tc-ECDを静脈内投与した際、同一の分解物が脊髄液中に確認されることより、^{99m}Tc-ECDは血液脳関門を透過後、エステル基が加水分解を受け、水溶性物質に分解されることにより脳実質に保持されると想定される⁴⁾。

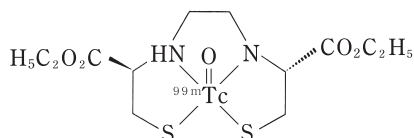
19. 有効成分に関する理化学的知見

19.1 [N,N'-エチレンジ-L-システイネート (3-)] オキソテクネチウム (^{99m}Tc), ジエチルエステル

分子式：C₁₂H₂₁N₂O₅S₂^{99m}Tc

分子量：436.44

化学構造式：



核物理学的特性 (^{99m}Tcとして)

- ・物理的半減期：6.015時間
- ・主なγ線エネルギー：141keV (89.1%)
- ・減衰表：

経過時間 (時間)	残存放射能 (%)	経過時間 (時間)	残存放射能 (%)	経過時間 (時間)	残存放射能 (%)
-3	141.3	9	35.4	21	8.9
-2	125.9	10	31.6	22	7.9
-1	112.2	11	28.2	23	7.1
0	100	12	25.1	24	6.3
1	89.1	13	22.4	25	5.6
2	79.4	14	19.9	26	5.0
3	70.8	15	17.8	27	4.5
4	63.1	16	15.8	28	4.0
5	56.2	17	14.1	29	3.5
6	50.1	18	12.6	30	3.2
7	44.6	19	11.2		
8	39.8	20	10.0		

20. 取扱い上の注意

放射線を安全に遮蔽できる貯蔵設備（貯蔵箱）に保存すること。

22. 包装

400MBq (2mL) [1シリンジ]、600MBq (3mL) [1シリンジ]

23. 主要文献

- 1) 久保敦司, ほか：核医学, 1992; 29: 1019-1027
- 2) 米倉義晴, ほか：核医学, 1993; 30: 397-410
- 3) Orlandi C, et al. : Stroke. 1990; 21: 1059-1063
- 4) Walovitch RC, et al. : J Nucl Med. 1989; 30: 1892-1901

*24. 文献請求先及び問い合わせ先

PDRファーマ株式会社 製品情報センター
電話番号 0120-383-624

〒104-0031 東京都中央区京橋2-14-1 兼松ビルディング

26. 製造販売業者等

*26.1 製造販売元

 **PDRファーマ株式会社**
東京都中央区京橋2-14-1 兼松ビルディング

26.2 技術提携先

Lantheus Medical Imaging, Inc. (米国)