

貯法：室温保存

有効期間：検定日時から2時間

日本標準商品分類番号

874300

承認番号

30300AMX00246000

販売開始

2024年7月

放射性医薬品・悪性腫瘍診断薬

放射性医薬品基準フルシクロビン (^{18}F) 注射液処方箋医薬品^{注)}

アキュミン[®]静注

AXUMIN Injection

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

®：登録商標

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	アキュミン静注
有効成分	1バイアル (2mL) 中 フルシクロビン (^{18}F) (検定日時において) 185MBq
添加剤	1バイアル (2mL) 中 日本薬局方D-マンニトール 3.64mg, 生理食塩液, pH調整剤

3.2 製剤の性状

販売名	アキュミン静注
外観	無色澄明の液
pH	2.8~4.8
浸透圧比	約1.4 (生理食塩液に対する比)

4. 効能又は効果

初発の悪性神経腫瘍が疑われる患者における腫瘍の可視化

ただし、磁気共鳴コンピューター断層撮影検査による腫瘍摘出計画時における腫瘍摘出範囲の決定の補助に用いる。

6. 用法及び用量

通常、本剤1バイアル (87~270MBq) を静脈内投与し、投与10~50分後にポジトロン断層撮影法により撮像を開始する。

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 本剤投与60分後までの範囲で撮像を行うこと。撮像時間は、投与量、撮像機器、データ収集条件、画像再構成のアルゴリズム及びパラメータ等を考慮して決定すること。[17.1.1参照]

7.2 FLAIR又はT2強調MRI画像で高信号領域かつ病理検査で腫瘍である部位においても、本剤の集積が認められないことがあるため、本剤を用いたPET検査では偽陰性が生じる可能性を考慮した上で、腫瘍摘出範囲を決定すること。[17.1.1参照]

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のみ投与すること。

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

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

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投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

11.2 その他の副作用

	1~5%未満	頻度不明
消化器	口渇	
その他		嗅覚錯誤, 注射部位紅斑, 注射部位疼痛, 味覚異常

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人6名に本剤174.4~201.4MBqを単回静脈内投与したとき、フルシクロビン (^{18}F) の血中及び血漿中放射能分布率の平均値は、投与後2分でそれぞれ7.68%ID及び6.71%IDを示した後、経時的に減少し、投与後240分ではそれぞれ3.13%ID及び1.98%IDとなった¹⁾。

16.3 分布

16.3.1 健康成人における臓器・組織当たりの放射能分布率の平均値は、全ての撮像時間点において筋肉で最大となり、次いで、肝臓、赤色骨髄及び肺などの臓器・組織で高い値を示した。これらの臓器・組織のうち、肝臓、赤色骨髄及び肺への分布は投与早期 (投与後3~10分) で最大となり (投与後3分又は10分における最大平均値は、それぞれ18.1%ID, 6.28%ID, 5.56%ID)、その後、徐々に消失した。また筋肉への分布は、投与後72分まで徐々に上昇し (109%ID)、その後、徐々に消失したが、投与後220分まで高い値を維持していた (95.8%ID)。脳への分布は、投与後220分まで徐々に上昇したが、全ての評価時間点においてほぼ一定であった (0.533~1.20%ID)¹⁾。

16.3.2 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。
実効線量は 0.0138mSv/MBq である¹⁾。

臓器	吸収線量 (mGy/MBq)
心臓壁	0.0239
肝臓	0.0406
筋肉	0.0248
脾臓	0.0308
脾臓	0.0213

16.4 代謝

本剤は肝臓にて代謝を受けず、血漿中及び尿中ではほとんどが未変化体として存在していることが示唆された¹⁾。

16.5 排泄

累積尿中放射能排泄率は経時的に増加し、投与直後から投与後 24 時間までの尿中放射能排泄率の平均値は 5.40%ID となった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相試験 (NMK36-BT-P301 試験)

臨床症状・経過及び MRI 検査から神経腫と疑われ、腫瘍摘出術を予定している患者 20 例を対象に本剤 87~270MBq を単回静脈内投与し、投与 10~50 分後に撮像を開始して 10 分間撮像した。NMK36-BT-P301 試験で本剤が投与された患者 25 例を併合して病理診断を真のスタンダードとしたとき、造影 T1 強調 MRI 画像で描出されないが本剤で描出される領域における本剤の陽性的中率は 88.0% (22/25 領域, 95%信頼区間: 75.3%-100.0%) であった (主要評価項目)。また、全採取組織における本剤の感度は 58.0% (29/50 領域), 特異度は 61.5% (8/13 領域), 造影 T1 強調 MRI 画像で描出されずかつ本剤で描出されない領域における本剤の陰性的中率は 30.8% (8/26 領域) であった (副次評価項目)²⁾。

副作用は 1/20 例 (5.0%) に認められ、口渇が 1 件であった。[7.1, 7.2 参照]

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

フルシクロビン (¹⁸F) は、血液脳関門を透過し³⁾、アミノ酸トランスポーターを介して細胞内に取り込まれるが⁴⁾、腫瘍細胞等では正常細胞よりもアミノ酸代謝が亢進していることから、正常細胞よりも腫瘍組織でより多く集積する。

19. 有効成分に関する理化学的知見

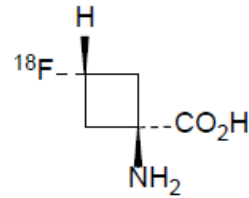
一般名: フルシクロビン (¹⁸F) (Fluciclovine (¹⁸F))

化学名: trans-1-アミノ-3-[¹⁸F]フルオロシクロブタン
カルボン酸

分子式: C₈H₈¹⁸FNO₂

分子量: 132.12

構造式:



核物理学的特性 (¹⁸Fとして):

- ・物理的半減期: 109.739分
- ・主γ線エネルギー: 511keV (放出率: 193.4%)

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。

21. 承認条件

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

22. 包装

185MBq (2mL) [1 パイアル]

23. 主要文献

- 1) 社内資料: 薬物動態 (2021 年 3 月 23 日承認, CTD 2.7.2.3)
- 2) 社内資料: 国内第Ⅲ相試験 (NMK36-BT-P301 試験) (2021 年 3 月 23 日承認, CTD 2.7.3.2)
- 3) 社内資料: 効力を裏付ける試験 (2021 年 3 月 23 日承認, CTD 2.6.2.2)
- 4) Okudaira H, et al. : J Nucl Med, 2011 ; 52 : 822-829

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本メジフィジックス株式会社
メディカルアフェアーズ部
〒136-0075 東京都江東区新砂 3 丁目 4 番 10 号
0120-07-6941 (フリーダイヤル)

26. 製造販売業者等

26.1 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