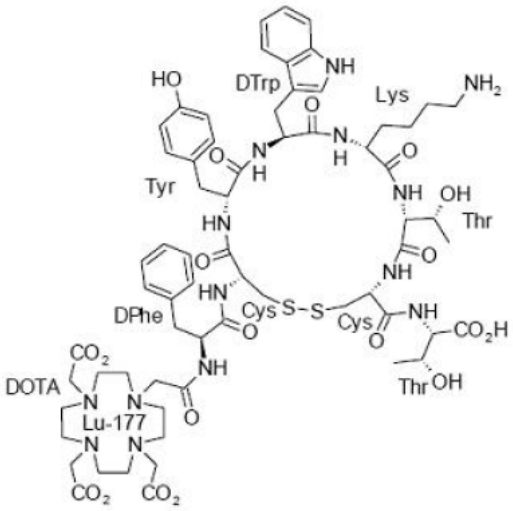
1.10 毒薬・劇薬等の指定審査資料のまとめ

1.10 毒薬・劇薬等の指定審査資料のまとめ

化学名・別名	INN lutetium (^{177}Lu) oxodotreotide 化学名 英名： hydrogen [*N*-{[4,7,10-tris(carboxylato-κ*O*-methyl)-1,4,7,10-tetraazacyclododecan-1-yl-κ^4*N*^{1},*N*^{4},*N*^{7},*N*^{10}]acetyl-κ*O*}-D-phenylalanyl-L-cysteinyl-L-tyrosyl-D-tryptophyl-L-lysyl-L-threonyl-L-cysteinyl-L-threoninato cyclic (2→7)-disulfide(4-)](^{177}Lu) lutetate(1-)
構造式	
効能・効果	ソマトスタチン受容体陽性の神経内分泌腫瘍
用法・用量	通常，成人にはルテチウムオキソドトレオチド (^{177}Lu) として 1 回 7.4 GBq を 30 分かけて 8 週間間隔で最大 4 回まで点滴静注する。なお，患者の状態により適宜減量する。
劇薬等の指定	
市販名及び有効成分・分量	原体：ルテチウムオキソドトレオチド (^{177}Lu) 製剤：ルタテラ静注 (1 バイアル (25mL) 中にルテチウムオキソドトレオチド (^{177}Lu) 7.4GBq (検定日時)含有)

	急性	概略の致死量 (μg/kg)	経口	皮下	腹腔	静脈
毒性*		マウス	NA	NA	NA	NA
		ラット	NA	NA	NA	20455 以上
		イヌ	NA	NA	NA	10000 以上
		サル	NA	NA	NA	NA

<table>
<tr><td rowspan="4"></td><td>亜急性</td><td>動物種</td><td>投与期間</td><td>投与経路</td><td>投与量
(μg/kg/日)</td><td>無毒性量
(μg/kg/日)</td><td>主な所見
等</td></tr>
<tr><td></td><td>ラット</td><td>42 日間
(2 週間に
1 回，計 4
回)</td><td>静脈</td><td>1250,
5000,
20000,</td><td>1250
(無作用量)</td><td>膵臓腺房細胞のアポトーシス，体重/摂餌量の減少 (雄のみ)</td></tr>
<tr><td></td><td>イヌ</td><td>43 日間
(2 週間に
1 回，計 4
回)</td><td>静脈</td><td>80,
500,
3200</td><td>80</td><td>唾液分泌の増加，異常発声，液状便，体温の上昇，摂餌量の減少，血漿中尿素の上昇，尿量の増加，尿浸透圧の低下，尿中クレアチニンの低下，尿中カリウム濃度の低下，膵臓腺房細胞のアポトーシス</td></tr>
<tr><td>慢性</td><td colspan="6">NA</td></tr>
<tr><td rowspan="8">副作用</td><td colspan="6">国内第 I 相臨床試験及び国内第 I/II 相臨床試験の併合解析（計 21 例）</td></tr>
<tr><td colspan="2">副作用の種類</td><td>例数</td><td>臨床検査異常の種類</td><td colspan="2">例数</td></tr>
<tr><td colspan="2">悪心</td><td>14 名 (66.7%)</td><td>リンパ球数減少</td><td colspan="2">10 名 (47.6%)</td></tr>
<tr><td colspan="2">食欲減退</td><td>11 名 (52.4%)</td><td>ALT 増加</td><td colspan="2">2 名 (9.5%)</td></tr>
<tr><td colspan="2">倦怠感</td><td>8 名 (38.1%)</td><td>AST 増加</td><td colspan="2">2 名 (9.5%)</td></tr>
<tr><td colspan="2">脱毛症</td><td>6 名 (28.6%)</td><td>γ-GTP 増加</td><td colspan="2">2 名 (9.5%)</td></tr>
<tr><td colspan="2">味覚障害</td><td>5 名 (23.8%)</td><td></td><td colspan="2"></td></tr>
<tr><td colspan="2"></td><td>：等</td><td></td><td colspan="2">：等</td></tr>
<tr><td>会社</td><td colspan="6">富士フイルム富山化学株式会社　　原体・製剤：輸入</td></tr>
</table>

* 非放射性の ^{175}Lu 標識体を被験物質とした試験結果を示す。

NA：データなし