

貯法：

2～8℃に保存

有効期間：3年

| | 10mg | 20mg | 30mg |
|------|------------------|------------------|------------------|
| 承認番号 | 22600AMX00244000 | 22600AMX00245000 | 22600AMX00513000 |
| 販売開始 | 2014年6月 | | |

持続性ソマトスタチンアナログ
マイクロスフェア型徐放性製剤
オクトレオチド酢酸塩徐放性製剤

サンドスタチン[®] LAR[®] 筋注用キット 10mg
サンドスタチン[®] LAR[®] 筋注用キット 20mg
サンドスタチン[®] LAR[®] 筋注用キット 30mg
Sandostatin[®] LAR[®] kit for i.m. injection

劇薬、処方箋医薬品
(注意 - 医師等の処方箋により使用すること)

 NOVARTIS

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

| 販売名 | サンドスタチン LAR筋注用キット 10mg | サンドスタチン LAR筋注用キット 20mg | サンドスタチン LAR筋注用キット 30mg |
|---------------------|---|--|---|
| 有効成分 ^{注1)} | 1バイアル中、オクトレオチド酢酸塩 11.2mg (オクトレオチドとして10mg) | 1バイアル中、オクトレオチド酢酸塩 22.4mg (オクトレオチドとして20mg) | 1バイアル中、オクトレオチド酢酸塩 33.6mg (オクトレオチドとして30mg) |
| 添加剤 ^{注1)} | 乳酸・グリコール酸共重合体 (11:9) グルコースエステル 188.8mg D-マンニトール 41.0mg | 乳酸・グリコール酸共重合体 (11:9) グルコースエステル 377.6mg D-マンニトール 81.9mg | 乳酸・グリコール酸共重合体 (11:9) グルコースエステル 566.4mg D-マンニトール 122.9mg |
| 専用分散液 (2mL) | 1シリンジ中、日局注射用水及び添加物としてカルメロースナトリウム14mg、D-マンニトール12mg、ポリオキシエチレン (160) ポリオキシシプロピレン (30) グリコール4mgを含有する。 | | |

注1) 本剤の実際の充填量は表示量より過量で、表示量を注射するに足りる量である。

3.2 製剤の性状

本製品は、サンドスタチンLAR筋注用（バイアル）及び専用分散液（シリンジ）^{注2)} からなるキット製品であり、用時懸濁して用いる注射剤である。

| 販売名 | サンドスタチン LAR筋注用キット 10mg | サンドスタチン LAR筋注用キット 20mg | サンドスタチン LAR筋注用キット 30mg |
|---------------------|------------------------|------------------------|------------------------|
| 性状 | 白色～帯黄白色の粉末 | | |
| pH ^{注3)} | 5.4～7.4 | 5.3～7.3 | 5.1～7.1 |
| 浸透圧比 ^{注4)} | 約0.6 (生理食塩液に対する比) | 約1.0 (生理食塩液に対する比) | 約1.5 (生理食塩液に対する比) |

注2) 既承認品目のサンドスタチンLAR筋注用の専用分散液（アンプル）と処方及び容器が異なる。

注3) 本剤1バイアルを専用分散液2mLで懸濁後

注4) 本剤1バイアルを専用分散液2mLで懸濁後の濾液

4. 効能又は効果

○下記疾患に伴う諸症状の改善

消化管ホルモン産生腫瘍（VIP産生腫瘍、カルチノイド症候群の特徴を示すカルチノイド腫瘍、ガストリン産生腫瘍）

○消化管神経内分泌腫瘍

○下記疾患における成長ホルモン、ソマトメジン-C分泌過剰状態及び諸症状の改善

先端巨大症・下垂体性巨人症（外科的処置、他剤による治療で効果が不十分な場合又は施行が困難な場合）

5. 効能又は効果に関連する注意

〈消化管ホルモン産生腫瘍及び先端巨大症・下垂体性巨人症〉

5.1 オクトレオチド酢酸塩注射液により有効性及び忍容性が確認されている患者に投与すること。

5.2 現在オクトレオチド酢酸塩注射液が投与されていない患者に本剤を投与する場合には、オクトレオチド酢酸塩注射液を2週間以上投与し、有効性及び忍容性を確認した上で本剤を投与すること。

〈下垂体性巨人症〉

5.3 脳性巨人症や染色体異常など他の原因による高身長例を鑑別し、下垂体性病変に由来するものであることを十分に確認すること。

6. 用法及び用量

〈消化管ホルモン産生腫瘍〉

通常、成人にはオクトレオチドとして20mgを4週毎に3ヵ月間、殿部筋肉内に注射する。その後は症状により10mg、20mg又は30mgを4週毎に投与する。ただし、初回投与後2週間は薬物濃度が十分な濃度に達しないことから、本剤投与前に投与していた同一用量のオクトレオチド酢酸塩注射液を併用する。

〈消化管神経内分泌腫瘍〉

通常、成人にはオクトレオチドとして30mgを4週毎に、殿部筋肉内に注射する。なお、患者の状態により適宜減量すること。

〈先端巨大症・下垂体性巨人症〉

通常、成人にはオクトレオチドとして20mgを4週毎に3ヵ月間、殿部筋肉内に注射する。その後は病態に応じて10mg、20mg又は30mgを4週毎に投与するが、30mg投与で効果が不十分な場合に限り40mgまで増量できる。

7. 用法及び用量に関連する注意

〈消化管ホルモン産生腫瘍〉

7.1 本剤投与中に症状が悪化した場合は、オクトレオチド酢酸塩注射液を併用することが望ましい。

〈先端巨大症・下垂体性巨人症〉

7.2 用量は、成長ホルモン濃度、インスリン様成長因子-I/ソマトメジン-C濃度及び臨床症状により10mg単位で適宜増減できる。

7.3 40mgの投与にあたっては、20mgずつを異なる2箇所注射する。

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 本剤の投与中はインスリン、グルカゴン及び成長ホルモン等互いに拮抗的に調節作用をもつホルモン間のバランスの変化による一過性の低又は高血糖を伴うことがあるので、投与開始時及び低又は高血糖のために投与量を変更する場合は患者を十分に観察すること。[11.2参照]

*8.2 胆石の形成又は胆石症の悪化（急性胆嚢炎、胆管炎、膵炎）が報告されているので、本剤の投与前及び投与中は、定

期的に（6～12ヵ月毎に）超音波・X線による胆嚢及び胆管検査を受けることが望ましい。[11.2参照]

〈先端巨大症・下垂体性巨人症〉

8.3 成長ホルモン産生下垂体腺腫は進展することがあり、これに伴い視野狭窄などの重篤な症状を生じることがあるので患者の状態を十分観察すること。腫瘍の進展が認められた場合は、他の治療法への切り替え等適切な処置を行うこと。

8.4 成長ホルモン及びインスリン様成長因子-I/ソマトメジン-Cを定期的に測定することが望ましい。

〈消化管神経内分泌腫瘍〉

8.5 がんに対する薬物療法について十分な知識・経験を持つ医師のもとで、本剤による治療が適切と判断される患者についてのみ使用すること。

8.6 本剤を使用する際には、関連文献（「医療上の必要性の高い未承認薬・適応外薬検討会議 公知申請への該当性に係る報告書：オクトレオチド酢酸塩（カルチノイド腫瘍のうち、無症候性かつ切除不能な転移性腫瘍）」等）を熟読すること。

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治療上の有益性が危険性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

治療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。動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。

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

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

10. 相互作用

10.2 併用注意（併用に注意すること）

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|----------|--|---|
| シクロスポリン | シクロスポリンの血中濃度が低下することがある。 | 本剤がシクロスポリンの吸収を阻害するため。 |
| インスリン製剤 | 血糖降下作用の増強による低血糖症状、又は減弱による高血糖症状があらわれることがある。併用する場合は、血糖値その他患者の状態を十分に観察しながら投与すること。 | インスリン、グルカゴン及び成長ホルモン等互いに拮抗的に調節作用をもつホルモン間のバランスが変化することがある。 |
| プロモクリプチン | プロモクリプチンのAUCが上昇したとの報告がある。 | 機序は不明である。 |

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 アナフィラキシー（頻度不明）

血圧低下、呼吸困難、気管支痙攣等のアナフィラキシーがあらわれることがある。皮疹、そう痒、蕁麻疹、発疹を伴う末梢性の浮腫等があらわれた場合には適切な処置を行うこと。また、その後の投与は行わないこと。

11.1.2 徐脈（1.3%）

重篤な徐脈を起こすことがある。β-遮断剤、カルシウム拮抗剤等の徐脈作用を有する薬剤又は水分や電解質を補正する薬剤を投与している患者において、徐脈が認められた場合、これらの用量を調節すること。

11.2 その他の副作用

| | 5%以上 | 1～5%未満 | 1%未満 | 頻度不明 |
|-------|------|--------|--|----------|
| 過敏症 | — | — | 発疹、そう痒 | 発赤 |
| 内分泌障害 | — | — | 甲状腺機能障害（甲状腺刺激ホルモン（TSH）減少、総サイロキシン（T ₄ ）減少及び遊離T ₄ 減少等） | 甲状腺機能低下症 |

| | 5%以上 | 1～5%未満 | 1%未満 | 頻度不明 |
|------------|------|--------------------|---------------------------|--|
| 代謝及び栄養障害 | — | 高血糖 ^{注5)} | 低血糖 ^{注5)} 、ALP上昇 | 耐糖能異常 ^{注5)} 、脱水 |
| 神経系障害 | — | 頭痛 | めまい | — |
| 呼吸器障害 | — | — | — | 呼吸困難 |
| 胃腸障害 | — | 下痢、便秘、腹部膨満 | 白色便、食欲不振、嘔気、鼓腸放屁 | 肺炎、胃部不快感、腹痛、嘔吐 |
| 肝胆道系障害 | — | 胆石症 ^{注6)} | — | 肝機能異常、胆管拡張、ALT上昇、γ-GTP上昇、ビリルビン上昇、AST上昇、胆嚢炎 |
| 皮膚及び皮下組織障害 | — | 脱毛 | — | — |
| 腎及び尿路障害 | — | 腎嚢胞 | — | — |
| 全身障害 | — | 疲労感 | — | けん怠感 |
| 注射部位 | 疼痛 | 硬結、腫脹 | 発赤 | — |

注5) [8.1参照]

注6) [8.2参照]

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

- 14.1.1 本剤の使用にあたっては、取扱い方法を熟読すること。
- 14.1.2 調製は必ず付属の専用分散液及びバイアルアダプターを使用し、薬剤及び専用分散液を少なくとも30分室温で静置し、内容物を室温に戻してから行うこと。
- 14.1.3 用時調製し、懸濁後は直ちに使用すること。

14.2 薬剤投与時の注意

- 14.2.1 筋肉内のみ投与し、静脈内には投与しないこと。
- 14.2.2 専用分散液は付属のものを用いること。
- 14.2.3 注射針は20ゲージを用いること。
- 14.2.4 筋肉内注射にあたっては下記の点に注意すること。
 - ・注射部位は殿部の左右外側上部とし、三角筋等の筋には投与しないこと。
 - ・繰り返し投与にあたっては左右交互に注射し、同一部位への投与は3ヵ月間は行わないこと。
 - ・神経走行部位及び血管内への投与を避けること。
 - ・注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり血液の逆流をみた場合は直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。
 - ・注射部位に疼痛、硬結をみることがある。
 - ・注射部位をもまないように患者に指示すること。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

- 15.1.1 海外においてオクトレオチド酢酸塩注射液により消化管ホルモン産生腫瘍の症状が管理されていた患者で症状管理が不可能になり、急激に症状が再発したとの報告がある。
- 15.1.2 オクトレオチド酢酸塩製剤を反復投与した患者に、抗オクトレオチド抗体が出現することがある。なお、抗体に起因すると考えられる特異的な副作用は認められていない。
- 15.1.3 本剤により脂肪の吸収が低下する可能性がある。海外においてオクトレオチド酢酸塩注射液の投与中に糞中の脂肪が増加したとの報告がある。
- 15.1.4 海外においてオクトレオチド酢酸塩注射液を投与された患者で、血清ビタミンB₁₂の低下、シリングテストでの異常値がみられたとの報告がある。

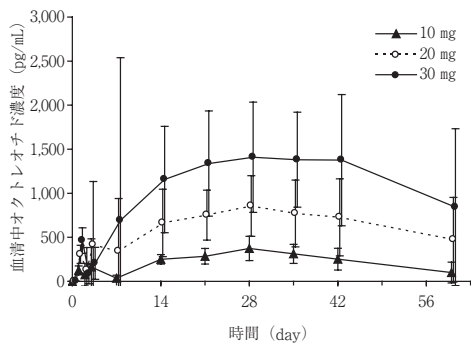
16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与（専用分散液（アンプル）のサンドスタチンLAR筋注用のデータ）

先端巨大症・下垂体性巨人症

外国人の先端巨大症患者にサンドスタチンLAR10mg、20mg及び30mgを単回筋肉内投与した時の血清中オクトレオチド濃度は、投与後25～34日にC_{max}に到達し、C_{max}の80%濃度を超える期間（Dur>80%C_{max}）は17～19日間であった。C_{max}及び投与後60日までの血清中濃度-時間曲線下面積（AUC_{0-60day}）はほぼ投与量に比例して増加した。また、日本人の先端巨大症・下垂体性巨人症患者にサンドスタチンLAR20mg及び30mgを単回筋肉内投与した時の薬物動態パラメータ（下表）の比較から、日本人と外国人の薬物動態に大きな差は認められなかった^{1,2)}。



外国人の先端巨大症患者にサンドスタチンLAR10mg、20mg及び30mgを単回筋肉内投与した時の血清中オクトレオチド濃度推移 (10mg : n=11, 20mg : n=33, 30mg : n=23, 平均値±標準偏差)

日本人及び外国人の先端巨大症・下垂体性巨人症患者にサンドスタチンLAR10mg、20mg又は30mgを単回筋肉内投与した時の薬物動態パラメータ

| 薬物動態パラメータ | サンドスタチンLAR | | | | |
|--------------------------------|-------------|-------------|------------------------|-------------|-------------|
| | 10mg | | 20mg | | 30mg |
| | 外国人 n=11 | 外国人 n=33 | 日本人 n=9 | 外国人 n=23 | 日本人 n=8 |
| Tmax (day) | 25±15 | 26±13 | 33.3±10.4 | 34±17 | 20.1±10.9 |
| Cmax (pg/mL) | 447±219 | 1,158±628 | 1,033±630 | 2,138±1,572 | 1,973±1,301 |
| AUC ^{0-60h} (ng·h/mL) | 307±97 | 877±394 | 767±435 | 1,549±686 | 1,419±836 |
| Dur>80%Cmax (day) | 17.9±11.2 | 17.3±10.2 | 15.6±7.7 ^{※2} | 19.2±8.9 | 12.7±10.6 |

※1 : 外国人ではAUC_{0-60day}、日本人ではAUC_{0-56day}、※2 : n=8

処方異なる専用分散液を用いた生物学的同等性試験

サンドスタチンLAR30mgを本キットに添付されている専用分散液（シリンジ）を用いて調製した群を試験製剤群とし、サンドスタチンLAR筋注用の専用分散液（アンプル）と同処方の海外専用分散液^{注7)}を用いて調製した群を標準製剤群として、生物学的同等性試験を実施した。その結果、両分散液を用いて懸濁した製剤は生物学的に同等であることが確認された³⁾。

注7) : 国内既承認品目のサンドスタチンLAR筋注用に添付されている専用分散液（アンプル）と添加物の配合比率は同一であるが、液量が異なる専用分散液（海外既承認品目のサンドスタチンLAR筋注用に添付されている専用分散液）（液量：国内2mL、海外2.5mL）

16.1.2 反復投与（専用分散液（アンプル）のサンドスタチンLAR筋注用のデータ）

(1) 先端巨大症・下垂体性巨人症患者

先端巨大症・下垂体性巨人症患者にサンドスタチンLAR20mgを4週毎に24週反復筋肉内投与した時には、投与2回目以降に定常状態となり、トラフ値は最低で1,147pg/mL、最高で1,643pg/mL、累積係数は最低で1.63、最高で1.97となった¹⁾。

(2) 悪性カルチノイド症候群患者

悪性カルチノイド症候群患者を対象にサンドスタチンLARの10mg、20mg及び30mgを4週毎に24週反復筋肉内投与した時の最終投与4週後の血清中オクトレオチド濃度（トラフ値）はそれぞれ1,155.1pg/mL、2,546.4pg/mL及び4,171.7pg/mLと投与量に比例して増加し、10mg投与では3回目、20mg及び30mg投与では2回目投与以降に定常状態に達したと考えられた⁴⁾（外国人データ）。

16.3 分布

全身循環血液中に移行したオクトレオチドは、サンドスタチン皮下注用静脈内投与時の薬物動態特性に従う。外国人の健康成人にサンドスタチン皮下注用を単回静脈内投与した場合、分布容積は約0.27L/kgであった⁵⁾。血漿蛋白結合率は約65%で、血球にはほとんど結合しない⁶⁾。

16.5 排泄

外国人の健康成人にサンドスタチン皮下注用を単回静脈内投与した場合、全身クリアランスは160mL/分であった⁵⁾。外国人の健康成人にサンドスタチン皮下注用50μgを単回皮下投与した場合、投与後8時間までの未変化体の累積尿中排泄率は約32%であった⁷⁾。胆管挿管ラットへの静脈内及び皮下投与では、約20%が尿中に、約75%が胆汁中に主に未変化体として排泄される⁸⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈先端巨大症・下垂体性巨人症〉

17.1.1 国内第Ⅰ/Ⅱ相試験

サンドスタチン皮下注用の投与により有効性及び忍容性が確認されている先端巨大症・下垂体性巨人症患者を対象とした第Ⅰ/Ⅱ相試験（非盲検、用量漸増、用量対照、皮下注射製剤対照、群間比較試験）において、本剤10～30mgを7回反復投与した。下表に示すとおり、血清成長ホルモン（以下GH）濃度はサンドスタチン皮下注用の反復投与時と同程度に抑制された。

| 観察時点 | | 血清GH濃度 (ng/mL) (n=18) | |
|-------------------------------|----------------------|-----------------------|---------------------|
| | | 平均値±標準偏差 | 中央値 (最小値, 最大値) |
| サンドスタチン皮下注用反復投与 ^{※1} | 4時間平均値 ^{※2} | 2.88±1.90 | 2.67 (0.32, 8.20) |
| | 3時間平均値 ^{※3} | 2.14±1.25 | 2.05 (0.34, 4.92) |
| 本剤投与前 | 2時間平均値 ^{※4} | 14.17±14.73 | 12.43 (2.63, 66.49) |
| 本剤7回反復投与28日後 | 2時間平均値 ^{※4} | 2.97±1.95 | 2.72 (0.46, 7.45) |

※1 : サンドスタチン皮下注用を投与すると、血清GH濃度は投与直前に比べて投与1時間後から4時間後にかけてほぼ一定の低値（底値）となる推移を示す。

※2 : サンドスタチン皮下注用の投与直前値を含めて、投与4時間後までの1時間毎の測定値の平均

※3 : サンドスタチン皮下注用の投与直前値を除いて、投与1時間後から4時間後までの1時間毎の測定値の平均

※4 : 本剤投与2時間前から投与直前まで、1時間毎の測定値の平均

第Ⅰ/Ⅱ相試験及び長期投与試験を通算した60週間での副作用発現頻度は90.9% (20/22例)であった。主な副作用は、注射部位硬結22.7% (5/22例)、注射部位疼痛及び血中ブドウ糖増加各18.2% (4/22例)、胆石症、胆道障害、腎囊胞及び薬物特異抗体陽性各13.6% (3/22例)であった⁹⁾。

〈先端巨大症〉

17.1.2 外国第Ⅱ相試験

サンドスタチン皮下注用の投与により有効性及び忍容性が確認されている先端巨大症患者を対象とした二重盲検群間比較単回投与試験 (93例)において、血清GH濃度は本剤10mg、20mg及び30mg投与によりサンドスタチン皮下注用の投与時と同程度に抑制された。引き続き非盲検反復投与試験として、本剤を10mgから60mgの範囲で、血清GH濃度等により10mg単位で用量調節しながら通算28回まで反復投与した結果、血清GH濃度はサンドスタチン皮下注用投与時の4.7ng/mLに対して、3.2ng/mLに抑制され、90例中48例 (53.3%)で2.5ng/mL未満まで抑制された。血清IGF-I濃度も86例中51例 (59.3%)で正常化 (500ng/mL未満)した。また、先端巨大症に伴う頭痛、発汗等の臨床症状を発現している例数も本剤投与前より減少した。なお、本試験で本剤40mgから60mgの用量が投与された25例において、血清GH濃度等による用量調節の結果、最終用量は20mgが1例、30mgが21例、40mgが3例であった¹⁰⁾。

17.1.3 外国第Ⅲ相試験

サンドスタチン皮下注用の投与により有効性及び忍容性が確認されている先端巨大症患者を対象に非盲検非対照試験として、本剤20mgを3回投与後、10～30mgを9回反復投与した結果、血清GH濃度は128例中89例 (69.5%)で2.5ng/mL未満に抑制された。血清IGF-I濃度の正常化率は、サンドスタチン皮下注用の投与時の63.3% (81/128例)に対して、本剤反復投与後では66.4% (85/128例)であった。先端巨大症に伴う臨床症状に対する効果はサンドスタチン皮下注用の投与時とほぼ同程度であった¹¹⁾。

〈消化管ホルモン産生腫瘍〉

17.1.4 国内第Ⅱ相試験

サンドスタチン皮下注用を対照とした非盲検群内比較試験として、サンドスタチン皮下注用の投与により有効性及び忍容性が確認されているカルチノイド腫瘍患者2例に本剤20mgを6回反復投与した結果、カルチノイド腫瘍に伴う臨床症状はサンドスタチン皮下注用の投与時とほぼ同程度に維持された。

第Ⅱ相試験及び28週以上にわたる長期投与試験での副作用発現頻度は100.0% (2/2例)であり、注射部位硬結及び胆石症各50.0% (1/2例)であった¹²⁾。

17.1.5 外国第Ⅲ相試験

多施設共同、無作為化、並行群間比較試験として、サンドスタチン皮下注用の投与により有効性及び忍容性が確認されている悪性カルチノイド症候群患者93例に対し、本剤10mg、20mg、30mg（二重盲検）及びサンドスタチン皮下注用（非盲検）を24週間投与した。本剤投与群ではサンドスタチン皮下注用を追加投与しなかった症例を奏効例とし、サンドスタチン皮下注用投与群では増量しなかった症例を奏効例とした際の奏効率は、本剤投与群とサンドスタチン皮下注用投与群ではほぼ同程度であった。また、各群とも悪性カルチノイド腫瘍に伴う臨床症状に対する効果はほぼ同程度であった。引き続き行われた長期投与試験において、悪性カルチノイド症候群患者78例に本剤20mgを4週毎に4回、続けて30mgを4週毎に9回反復投与したところ、悪性カルチノイド腫瘍に伴う臨床症状に対する効果は持続し、また24時間尿中5-HIAA排泄量は持続的に抑制された。副作用発現頻度は46.7%（43/92例）であった。主な副作用は胆石症12.0%（11/92例）、便秘9.8%（9/92例）、鼓腸放屁8.7%（8/92例）、腹痛7.6%（7/92例）及び嘔気5.4%（5/92例）であった¹³⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

18.1.1 本剤はソマトスタチン受容体サブタイプ1～5（SSTR1～5）のうちSSTR2に特に強い親和性を示し、SSTR2選択的ソマトスタチンアナログであると考えられた（*in vitro*）。

18.1.2 本剤は、細胞を用いた検討において、カルシウムイオン流入の阻害作用、cAMP産生の抑制作用を示した（*in vitro*）。

18.2 薬理作用

18.2.1 オクトレオチドはVIP産生腫瘍患者において血中VIP濃度を低下させる^{14,15)}。

18.2.2 オクトレオチドはカルチノイド症候群の患者において、セロトニンの主要代謝物である5-HIAAの尿中排泄量を低下させる¹⁶⁾。

18.2.3 オクトレオチドはガストリン産生腫瘍患者において血中ガストリン濃度を低下させる¹⁷⁾。

18.2.4 オクトレオチドは先端巨大症患者の下垂体腺腫細胞からのGH放出を抑制する（*in vivo*¹⁸⁾、*in vitro*¹⁹⁾）。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称

オクトレオチド酢酸塩（Octreotide Acetate）

化学名

(-) -D-Phenylalanyl-L-cysteinyl-L-phenylalanyl-D-tryptophyl-L-lysyl-L-threonyl-N- [(1R, 2R) -2-hydroxy-1-(hydroxymethyl) propyl] -L-cysteinamide cyclic (2→7) disulfide diacetate

分子式

C₄₉H₆₆N₁₀O₁₆S₂ · 2CH₃COOH

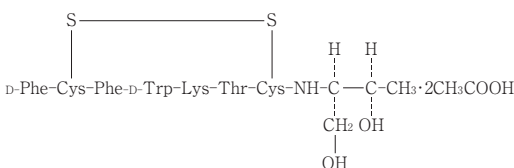
分子量

1139.34

性状

白色～微黄白色の粉末である。水に極めて溶けやすく、メタノール、酢酸（100）、エタノール（95）又は1-ブタノールに溶けやすく、アセトニトリルに極めて溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。本品の水溶液（1→100）のpHは5.0～7.0である。吸湿性である。

化学構造式



20. 取扱い上の注意

外箱開封後は遮光して保存すること。

22. 包装

〈サンドスタチンLAR筋注用キット10mg〉

1バイアル、専用分散液2mL（シリンジ）（バイアルアダプター1個添付）

〈サンドスタチンLAR筋注用キット20mg〉

1バイアル、専用分散液2mL（シリンジ）（バイアルアダプター1個添付）

〈サンドスタチンLAR筋注用キット30mg〉

1バイアル、専用分散液2mL（シリンジ）（バイアルアダプター1個添付）

23. 主要文献

- 1) 社内資料：先端巨大症・下垂体性巨人症患者における薬物動態成績 [20042803]
- 2) 社内資料：外国人の先端巨大症・下垂体性巨人症患者における薬物動態成績 [20042804]
- 3) 社内資料：外国人健康成人における生物学的同等性試験成績 [20136559]
- 4) 社内資料：外国人の悪性カルチノイド症候群患者における薬物動態成績 [20042805]
- 5) 社内資料：外国人健康成人における薬物動態パラメータ [20042806]
- 6) 社内資料：ヒトにおける血漿蛋白結合及び血球移行性 [20042807]
- 7) 社内資料：外国人健康成人における尿中排泄率 [20042817]
- 8) 社内資料：胆管挿管ラットにおける放射能及び未変化体の排泄 [20042808]
- 9) 社内資料：末端肥大症・下垂体性巨人症患者を対象とした国内第Ⅰ/Ⅱ相試験 [20042809]
- 10) 社内資料：先端巨大症患者を対象とした海外第Ⅱ相試験 [20042818]
- 11) 社内資料：先端巨大症患者を対象とした海外第Ⅲ相試験 [20042811]
- 12) 社内資料：消化管ホルモン産生腫瘍患者を対象とした国内第Ⅱ相試験 [20042810]
- 13) 社内資料：悪性カルチノイド症候群を対象とした海外第Ⅲ相試験 [20042812]
- 14) 前田征洋ほか：日本内科学会雑誌 1988;77 (1) :86-90 [19886642]
- 15) 吉岡光明ほか：日本内科学会雑誌 1988;77 (8) :1276-1277 [19886647]
- 16) Kvols, L. K. et al. : New Engl. J. Med. 1986;315 (11) :663-666 [19967593]
- 17) 福島英生ほか：日本内分泌学会雑誌 1988;64 (8) :666-676 [19886663]
- 18) 島津 章ほか：日本内分泌学会雑誌 1989;65 (7) :640-652 [19896530]
- 19) Lamberts, S. W. J. et al. : Clin. Endocrinol. 1987;27 (1) :11-23 [19967607]

24. 文献請求先及び問い合わせ先

ノバルティスファーマ株式会社 ノバルティスダイレクト
〒105-6333 東京都港区虎ノ門1-23-1

NOVARTIS DIRECT

0120-003-293

受付時間：月～金 9:00～17:30
（祝祭日及び当社休日を除く）

www.novartis.co.jp

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売

ノバルティス ファーマ株式会社
東京都港区虎ノ門 1-23-1

(05)