

貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示

前立腺肥大症治療剤

| | |
|------|------------------|
| 承認番号 | 20800AMZ00050000 |
| 薬価収載 | 1996年7月 |
| 販売開始 | 1996年7月 |

処方箋医薬品^{注)}

コバレノール錠25

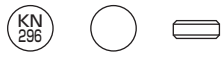
COBARENOL Tablets 25
アリルエストレノール錠

注)注意-医師等の処方箋により使用すること

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

重篤な肝障害・肝疾患のある患者[肝機能障害の増悪があらわれることがある。]

【組成・性状】

| | |
|-------|---|
| 品名 | コバレノール錠25 |
| 成分・含量 | 1錠中、アリルエストレノール25mg含有 |
| 添加物 | 乳糖水和物、パレイシヨデンブ、カルメロースカルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ラウリル硫酸ナトリウム、トコフェロール、ステアリン酸マグネシウム |
| 性状 | 白色の素錠 |
| 大きさ | 直径：約7.1mm 厚さ：約2.6mm 重量：約125mg |
| 外形 |  |
| 識別コード | KN296 |

【効能・効果】

前立腺肥大症

【用法・用量】

通常、成人にはアリルエストレノールとして1回25mg(1錠)を1日2回経口投与する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1)心疾患・腎疾患の患者又はその既往歴のある患者[ナトリウム又は体液の貯留があらわれることがある。]
- (2)ポルフィリン症の患者 [黄体ホルモンでポルフィリン及びその代謝物の排泄遅延により症状を悪化させることが報告されており、本剤においても症状を悪化させるおそれがある。]

2. 重要な基本的注意

- (1)本剤による前立腺肥大症に対する治療は、根治療法ではないことに留意し、本剤投与により期待する効果が得られない場合には、手術療法等他の適切な処置を考慮すること。
- (2)投与期間は16週間を基準とし、期待する効果が得られない場合には、以後漫然と投与を継続しないこと。

3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

| | 頻度不明 |
|-----------------------|--|
| 過敏症 ^(注1) | 発疹、蕁麻疹 |
| 肝臓 ^(注2) | AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、LDH上昇、ビリルビン値上昇、肝機能障害 |
| 電解質代謝 ^(注3) | 浮腫、体重増加 |
| 生殖器 | インポテンス、ポテンツ低下、性欲減退 |
| 血液 | 貧血、白血球減少 |
| 内分泌 | 女性型乳房、男性乳房痛 |
| 循環器 | 動悸、息切れ |

| | 頻度不明 |
|-------|-----------------------|
| 消化器 | 食欲不振、嘔吐、胸やけ、胃部不快感、吐き気 |
| 精神神経系 | めまい |
| 糖代謝 | 高血糖、尿糖 |
| 脂質代謝 | 中性脂肪上昇 |
| 腎臓 | BUN上昇 |
| その他 | 発汗、熱感、倦怠感 |

注1) 投与を中止すること。

注2) 観察を十分に行い、減量又は休業等の適切な処置を行うこと。

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注意すること。

5. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

【薬物動態】

<生物学的同等性試験>

コバレノール錠25と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(アリルエストレノール25mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された(図、表)。¹⁾

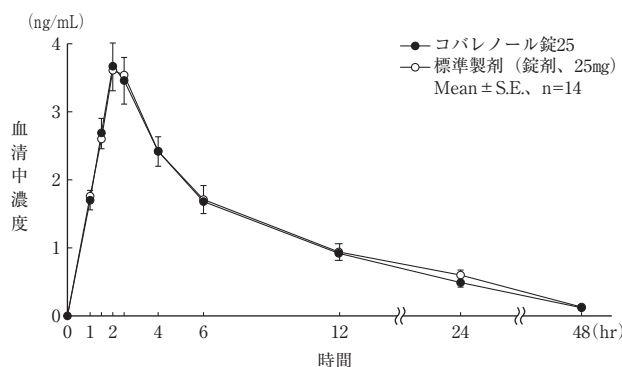


図 アリルエストレノールの血清中濃度推移

表 薬物動態パラメータ

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|-------------------|-------------------------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|
| | AUC _{0→48hr} (ng・hr/mL) | C _{max} (ng/mL) | T _{max} (hr) | T _{1/2} (hr) |
| コバレノール錠25 | 38.38±3.24 | 3.76±0.35 | 2.14±0.06 | 10.2±0.6 |
| 標準製剤 (錠剤、25mg) | 39.87±3.71 | 3.90±0.25 | 2.21±0.07 | 10.3±0.7 |

(Mean ± S.E., n = 14)

血清中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

<溶出挙動>

コバレノール錠25は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたアリルエストレノール錠の溶出規格に適合していることが確認されている。²⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アリルエストレノール (Allylestrenol)

化学名：17 α -allyl-17 β -hydroxy-estr-4-ene

分子式：C₂₁H₃₂O

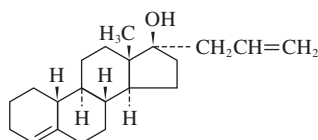
分子量：300.48

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

エタノール(95)、アセトン、クロロホルム又は1,4-ジオキサンに極めて溶けやすく、メタノール又はジエチルエーテルに溶けやすく、水にほとんど溶けない。

融点：78～81℃

構造式：



【取扱い上の注意】

*<安定性試験>

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、3年間)の結果、コバレノール錠25は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。³⁾

**【包装】

PTP：100錠

【主要文献】

- 1) 小林化工株式会社・社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 小林化工株式会社・社内資料(品質再評価溶出試験)
- 3) 小林化工株式会社・社内資料(安定性試験)

【文献請求先】


主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

小林化工株式会社 安全管理部

〒919-0603 福井県あわら市矢地5-15

☎ 0120-37-0690 TEL 0776-73-0911

FAX 0776-73-0821

製造販売元
 **小林化工株式会社**
福井県あわら市矢地5-15