

貯 法：しゃ光して室温保存  
使用期限：外箱、容器に使用期限  
を表示

処方せん医薬品<sup>注1)</sup>

## 持続性蛋白同化ステロイド剤

日本薬局方

メテノロンエナント酸エステル注射液

# プリモボラン®・デポー筋注100mg

Primobolan®-Depot intramuscular injection

承認番号	22000AMX00214000
薬価収載	2008年4月
販売開始	2005年5月
再評価結果	1976年7月

注1) 注意—医師等の処方せんにより使用すること

### 【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

- ※ (1) アンドロゲン依存性悪性腫瘍（例えば前立腺癌）及びその疑いのある患者〔症状を悪化させるおそれがある〕
- (2) 妊婦又は妊娠している可能性のある女性（「6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）

### 【組成・性状】

販売名	プリモボラン・デポー筋注 100mg
成分・含量	1管（1mL）中、日局メテノロンエナント酸エステル 100mg含有
添加物	ゴマ油 832.7mg
色・性状	微黄色澄明の油性注射液

### 【効能・効果】

骨粗鬆症

下記疾患による著しい消耗状態

慢性腎疾患、悪性腫瘍、手術後、外傷、熱傷

下記疾患による骨髄の消耗状態

再生不良性貧血

### 【用法・用量】

メテノロンエナント酸エステルとして、通常、成人1回100mgを1～2週間ごとに筋肉内注射する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

### 【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) 前立腺肥大のある患者〔症状を悪化させるおそれがある〕
- (2) 心疾患・腎疾患のある患者〔ナトリウム又は体液の貯留があらわれることがある〕
- (3) 肝疾患のある患者〔症状を悪化させることがある〕
- (4) 癌の骨転移のある患者〔高カルシウム血症があらわれるおそれがある〕
- (5) 高齢者（「5. 高齢者への投与」の項参照）
- (6) 糖尿病の患者〔耐糖能の低下がみられることがある〕

#### 2. 重要な基本的注意

- (1) 男性に投与する場合は、定期的に前立腺の検査を行うこと。
- (2) 女性に投与する場合は、変声の可能性のあることを告げておくこと。

※※(3) 肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、

特に長期投与する場合には、定期的に臨床検査（肝機能検査等）を行うこと。

### 3. 相互作用

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
副腎皮質ホルモン剤	耐糖能の低下がみられることがある。観察を十分に行い慎重に投与すること。	機序は不明
クマリン系抗凝血剤（ワルファリンカリウム等）	これらの作用を増強することがある。観察を十分に行い慎重に投与すること。	機序は不明

### ※※4. 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。

#### (1) 重大な副作用（頻度不明）

**肝機能障害、黄疸**：AST (GOT)、ALT (GPT)、 $\gamma$ -GTP等の著しい上昇を伴う肝機能障害や黄疸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し、適切な処置を行うこと。

#### (2) その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、このような場合には適切な処置を行うこと。

種類	頻度	頻度不明
過敏症 <sup>注2)</sup>		過敏症状
肝 臓		AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇
胃 腸		悪心、嘔吐
その他 <sup>注2)</sup>	女性	嗄声（進行すると回復困難な場合がある。通常、月経異常が先発する例が多いとの報告がある。）、多毛、痤瘡、色素沈着、月経異常、陰核肥大、性欲亢進
	男性	痤瘡、陰茎肥大、陰萎、持続性勃起、大量継続投与による精子減少・精液減少等の睾丸機能抑制

注2) 投与を中止すること。

### 5. 高齢者への投与

高齢者ではアンドロゲン依存性腫瘍が潜在している可能性があること、及び一般に生理機能が低下しているため慎重に投与すること。

### 6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

女性胎児の男性化を起こすおそれがあるため、妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。

7. 小児等への投与

骨端の早期閉鎖、性的早熟を来すことがあるので、観察を十分に行い慎重に投与すること。

8. 適用上の注意

- (1) 投与経路：筋肉内注射にのみ使用すること。
- (2) 開封時：アンプルカット時には異物混入を避けるためエタノール綿等で清拭しカットすること。
- (3) 投与时：筋肉内注射にあたっては、組織、神経等への影響を避けるため下記の点に注意すること。
  - ①同一部位への反復注射は行わないこと。特に新生児、乳児、幼児、小児には注意すること。
  - ②神経走行部位を避けること。
  - ③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。
  - ④注射部位に疼痛、硬結をみることもある。

9. その他の注意

蛋白同化ステロイド剤を長期大量に投与された再生不良性貧血の患者等に肝腫瘍の発生が観察されたとの報告がある。<sup>1)~3)</sup>

【薬物動態】

吸収・排泄

健康人に<sup>14</sup>C-メテノロンエナント酸エステル100mgを筋注すると、投与後8日目と10日目に最高血中濃度を示した。尿中には21日目までに46.87%~59.08%が排泄され、糞便中には、20日目までに11.46%~14.24%が排泄された。なお、総排泄量としては21日目までに投与量の59.85%~73.32%が排泄され、尿中排泄量は総排泄量の約80%であった。<sup>4)</sup> (外国データ)

【薬効薬理】

1. N貯留作用

患者にメテノロンエナント酸エステル100mgを筋注すると、N貯留は注射後3日目にあらわれ約12日間持続し、その貯留量は1日平均3.34gでテストステロンエナント酸エステルの約2倍である。<sup>5)</sup>

2. Ca、P貯留作用

患者にメテノロンエナント酸エステル100mgを筋注するとCa、Pの貯留が12日間持続する。<sup>5)</sup>

3. 肛門挙筋重量増加

去勢1週間後のラットにメテノロンエナント酸エステル10mgを皮下投与すると、4週後に肛門挙筋重量が最大値に達し、その後緩やかに減少する。<sup>6)</sup>

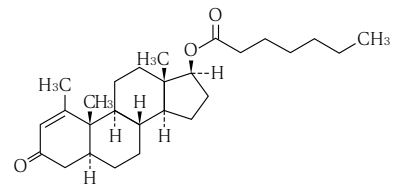
4. 造血作用

ラットに抗癌剤投与・X線全身照射を行ない、同時にメテノロンエナント酸エステル10mg/kgを3日毎に3回、あるいは5回筋肉内投与すると、赤血球造成、血

小板造成、白血球造成がみられる。<sup>7)</sup>

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：メテノロンエナント酸エステル (Metenolone Enanthate)

化学名：1-Methyl-3-oxo-5 $\alpha$ -androst-1-en-17 $\beta$ -yl heptanoate

分子式：C<sub>27</sub>H<sub>42</sub>O<sub>3</sub>

分子量：414.62

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

溶解性：本品はエタノール(95)、アセトン、1,4-ジオキサン又はクロロホルムに極めて溶けやすく、メタノール、酢酸エチル、ジエチルエーテル、シクロヘキサン、石油エーテル又はトルエンに溶けやすく、ゴマ油にやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

アンプルは「ワンポイントカットアンプル」を使用しているため、ヤスリを用いず、アンプル枝部のマーク(白)の反対方向に折り取ること。

【包装】

100mg/1 mL 10管

【主要文献】

- 1) Johnson, F.L. et al. : Lancet 2 (7790) : 1273 (1972)
- 2) Oda, K. et al. : Acta Haematol. JPN 50 (1) : 29 (1987)
- 3) Haupt, H.A. et al. : Am. J. Sports Med. 12 (6) : 469 (1984)
- 4) Kolb, K.H. : 社内資料 (1968)
- 5) Weller, O. : Endokrinologie 42 (1/2) : 34 (1962)
- 6) Suchowsky, G.K. et al. : Acta Endocrinol. 39 : 68 (1962)
- 7) Obrecht, P. et al. : Vortrag, gehalten auf der Schweizerischen Krebsstagung 1.12.1967, Basel

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきまして下記にご請求下さい。  
 富士製薬工業株式会社 富山工場 学術情報課  
 〒939-3515 富山県富山市水橋辻ヶ堂1515番地  
 (TEL) 076-478-0032  
 (FAX) 076-478-0336