

処方せん医薬品：注意－医師等の処方せんにより使用すること

前立腺疾患治療剤

サキオジール錠25mg

Sakiodil® Tablets

(クロルマジノン酢酸エステル錠)

貯 法：室温保存

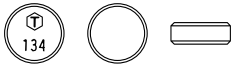
使用期限：5年
(容器に表示の使用期限内に使用すること)

承認番号	21800AMX10765
薬価収載	2006年12月
販売開始	1988年3月
効能追加	1988年9月

【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〔代謝能が低下しており肝臓への負担が増加するため、症状が増悪することがある。〕

【組成・性状】

販 売 名	サキオジール錠25mg
成分・含量 (1錠中)	日本薬局方 クロルマジノン酢酸エステル 25mg
添 加 物	トウモロコシデンプン、乳糖水和物、カルメロースNa、クロスカルメロースNa、エチルセルロース、ステアリン酸Mg、無水ケイ酸
性 状	白色～微黄色の素錠で、におい及び味はない。
外 形	
大 き さ	直径：8.0mm 厚み：3.0mm 質量：約200mg
識別コード	本体：①134 PTP：TYK134

【効能・効果】

前立腺肥大症

前立腺癌

但し、転移のある前立腺癌症例に対しては、他療法による治療の困難な場合に使用する。

【用法・用量】

前立腺肥大症

クロルマジノン酢酸エステルとして、1回25mg(本剤：1錠)を1日2回、食後に経口投与する。

前立腺癌

クロルマジノン酢酸エステルとして、1回50mg(本剤：2錠)を1日2回、食後に経口投与する。
なお、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)

- 心疾患、腎疾患又はその既往歴のある患者〔ナトリウムや体液の貯留により、これらの症状が増悪することがある。〕
- 糖尿病患者〔耐糖能の低下があらわれることがある。〕

2. 重要な基本的注意

- 劇症肝炎等の重篤な肝機能障害による死亡例が報告されているので、投与開始後3カ月までは少なくとも1カ月に1回、それ以降も定期的に肝機能検査を行うこと。
- 前立腺肥大症に使用する場合は次の点に留意すること。
 - 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。

- 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。
- ポテンツ低下等があらわれた場合、治療上の有益性を考慮の上、必要に応じ休業又は他の療法への変更を行うこと。

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。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

- うっ血性心不全：うっ血性心不全があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 血栓症：血栓症(脳、心、肺、四肢等)があらわれることがあるので、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。
- 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸：本剤投与1～2カ月後に劇症肝炎、肝機能障害、黄疸があらわれ、死亡に至った症例が報告されているので、投与開始後3カ月間は少なくとも1カ月に1回、それ以降も定期的に肝機能検査を行い、悪心・嘔吐、食欲不振、全身倦怠感等の異常が認められた場合には直ちに投与を中止し適切な処置を行うこと。
- 糖尿病(悪化を含む)、高血糖：糖尿病、糖尿病の悪化あるいは高血糖があらわれることがあり、昏睡、ケトアシドーシスを伴う重篤な症例も報告されているので、血糖値や尿糖に注意するなど観察を十分に行い、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。

(2) その他の副作用

種類	頻度	頻度不明
生殖 器		インポテンス、性欲低下等
過 敏 症 ^{注1)}		発疹、そう痒等
肝 臓 ^{注2)}		肝機能異常等
腎 臓 ^{注3)}		BUN、クレアチニンの上昇等
電解質代謝 ^{注4)}		浮腫、体重増加等
循 環 器 ^{注3)}		動悸、心悸亢進、胸内苦悶、息切れ等
血 液		貧血
消 化 器		胃部不快感、悪心、便秘、下痢、食欲不振、口渇、嘔吐、腹痛等
精神神経系		頭痛、眠気等
泌 尿 器		頻尿、尿道不快感、下腹部痛等
脂 質 代 謝		中性脂肪の上昇
内 分 泌		女性型乳房、血中FSH、LH、テストステロン値の低下、プロラクチン値の上昇
皮 膚		脱毛
そ の 他		倦怠感、微熱、発汗、肥満

注1) 発現した場合には投与を中止すること。

注2) 肝機能検査値に注意するなど観察を十分に行い、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。

注3) 発現した場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

注4) 観察を十分に行い、発現した場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

4. 高齢者への投与

高齢者への投与の際には用量並びに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。〔一般に高齢者では生理機能が低下していることが多いため、血中濃度が持続するおそれがある。〕

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、更には穿孔を起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。〕

6. その他の注意

ラット、ウサギ及びイヌにおいて精子形成異常が認められるという報告がある。

また、副腎皮質はラット及びイヌでは萎縮するという報告があるが、モルモットでは萎縮しないという報告がある。

【薬物動態】

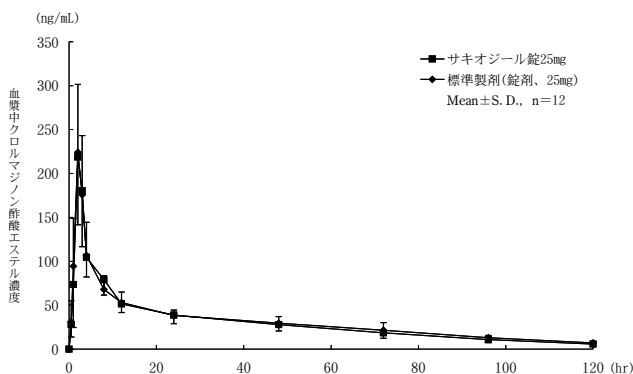
1. 生物学的同等性試験

(参考) 動物¹⁾

サキオジール錠25mgと標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ1錠(クロルマジノン酢酸エステルとして25mg)健康なビーグル犬に空腹時単回経口投与して血漿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。

	AUC ₀₋₁₂₀ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
サキオジール錠25mg	3600.15±629.69	254.46±39.47	2.25±0.45	43.53±16.18
標準製剤(錠剤、25mg)	3759.95±488.89	258.90±47.04	2.42±0.51	38.21±12.96

(Mean±S. D., n=12)



血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験動物の選択、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。

2. 溶出挙動²⁾

サキオジール錠25mgは、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたクロルマジノン酢酸エステル25mg錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：〔日局〕クロルマジノン酢酸エステル

(Chlormadinone acetate)

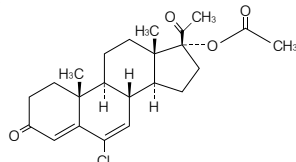
〔日局別名〕酢酸クロルマジノン

化学名：6-Chloro-3, 20-dioxopregna-4, 6-dien-17-yl acetate

分子式：C₂₃H₂₉ClO₄

分子量：404.93

構造式：



性状：白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

クロロホルムに溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けやすく、エタノール(95)又はジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点：211～215℃

【取扱い上の注意】

安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温保存、5年6カ月)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、サキオジール錠25mgは通常の市場流通下において5年間安定であることが確認された。

※※【包装】

PTP 100錠

【主要文献】

- 1) 大正薬品工業(株) 社内資料：生物学的同等性試験(ビーグル犬)
- 2) 大正薬品工業(株) 社内資料：溶出試験
- 3) 大正薬品工業(株) 社内資料：安定性試験

※※【文献請求先】

ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053

®登録商標

【製造販売元】

大正薬品工業株式会社

滋賀県甲賀市甲賀町大原市場3番地

※※【販売】

ファイザー株式会社

東京都渋谷区代々木3-22-7

※※【提携】

マイラン製薬株式会社

大阪市中央区本町2丁目6番8号