



※2010年10月改訂(第9版：社名変更等に伴う改訂)
 ※2009年8月改訂

| |
|------------|
| 日本標準商品分類番号 |
| 872479 |

処方箋医薬品：注意-医師等の処方箋により使用すること

前立腺肥大症治療剤

| | |
|-------|------------------|
| 承認番号 | 21800AMX10432000 |
| 薬価収載 | 2006年12月 |
| 販売開始 | 1990年9月 |
| 再審査結果 | 1998年3月 |

パーセリン®錠 25mg

貯法：室温保存
 ※使用期間：3年
 使用期限：包装に表示の使用期限内に使用すること。

Perselin® Tablets 25mg

アリルエストレノール錠



【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】

1. 組成

1錠中に次の成分を含有

| 販売名 | 有効成分 | 添加物 |
|--------------|-------------------|---|
| パーセリン®錠 25mg | アリルエストレノール 25.0mg | バレイショデンブン、ヒドロキシプロピルセルロース、トコフェロール、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、乳糖水和物 |

2. 性状

パーセリン®錠25mg：白色の素錠

| 販売名 | 識別コード | 外形等 |
|--------------|-----------------|---|
| パーセリン®錠 25mg | GK7 ☆ORGANON | 重さ(mg)・直径(mm)・厚さ(mm) 125 7.1 3.2 |

【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(本項には頻度が算出できない副作用報告を含む。)

総症例5,116例中169例(3.30%)に副作用が認められた。その主なものは、性欲減退・ポテンツ低下・インポテンスなど(1.25%)、LDH上昇(0.29%)、AST(GOT)上昇

(0.22%)、ALT(GPT)上昇(0.20%)、貧血(0.20%)等であった。 [再審査終了時]

| | 副作用の頻度 | | |
|----------------------|------------|---|-----------------|
| | 頻度不明 | 0.1~5%未満 | 0.1%未満 |
| 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2)} | 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 |
| 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。

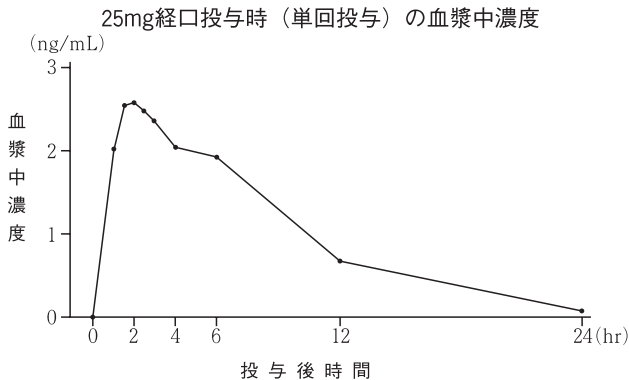
5. 適用上の注意

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】

血中濃度

健康成人5例にアリルエストレノール25mgを1回経口投与した場合、投与後約2時間で最高値に達し、半減期は約10時間であり、投与後48時間にはほぼ血漿中から消失した。



| パラメータ | AUC (ng/mL・hr) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | T ¹ / ₂ (hr) |
|-----------------|-------------------|-----------------|--------------|---------------------------------------|
| 投与量 25mg(1錠) | 25.9 | 2.9 | 2.7 | 10.7 |

(科学技術研究所)

【参考：動物】

分布・排泄¹⁾

ラットに³H-アリルエストレノール1mg/kgを経口投与したとき、投与後48時間までに16~20%が胆汁中へ排泄され、投与後96時間の尿中及び糞中排泄率はそれぞれ約24%、68%であった。また、雄ラットにおける組織内濃度はすべての組織で投与後6時間で最高濃度に達し、肝、消化管及び副腎で高濃度を示した。

【臨床成績】^{2~11)}

- 前立腺肥大症患者を対象とした二重盲検比較試験により、また、前立腺肥大症患者の性機能に及ぼす影響について検討した二重盲検比較試験により、本剤の有用性が認められた。
- 前立腺肥大症患者を対象として、国内65施設で実施された臨床試験成績の概要は次のとおりであった。

| 対象疾患名 | 改善例数/効果判定例数 | 改善率 (%) 【中等度改善以上】 |
|--------|-------------|----------------------|
| 前立腺肥大症 | 97/181 | 53.6 |

【薬効薬理】¹²⁾

アリルエストレノールは前立腺肥大症に対し、前立腺の肥大抑制又は肥大結節の縮小効果が認められており、その作用機序は前立腺において直接アンドロゲンと競合拮抗することによると考えられている。

1. アンチアンドロゲン作用

(1) 外因性アンドロゲンへの拮抗作用

幼若去勢ラットにテストステロンを投与した実験で、本剤の投与により、アンドロゲン標的臓器である前立腺及び精のうの発育肥大が抑制されることが認められ、その抑制効果は用量依存的である。

(2) 内因性アンドロゲンへの拮抗作用

成熟ラットによる実験で、本剤の投与により前立腺及び精のう重量を減少させることが認められている。

2. 作用機序

- 前立腺細胞内に選択的に取込まれ、アンチアンドロゲン作用を示す。
- 血中テストステロンの前立腺細胞内への選択的取込み阻害作用を示す。
- テストステロンから5 α -ジヒドロテストステロン(5 α -DHT)への還元阻害作用を示す。
- 5 α -DHT・サイトソールレセプター複合体形成阻害作用を示す。

【有効成分に関する理化学的知見】

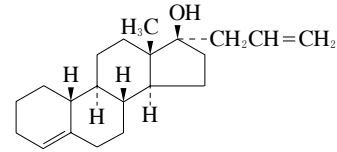
一般名：アリルエストレノール(Allylestrenol)

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

分子式：C₂₁H₃₂O

分子量：300.48

構造式：



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℃

【包装】

パーセリン[®]錠25mg

100錠(PTP)

500錠(PTP)

【主要文献】

- 1) 江角凱夫ほか：基礎と臨床 20, 4628 (1986)
- 2) 志田圭三ほか：基礎と臨床 19, 7341 (1985)
- 3) 岩井省三ほか：診療と新薬 22, 3113 (1985)
- 4) 仲田浄治郎ほか：診療と新薬 23, 436 (1986)
- 5) 田島 惇ほか：泌尿紀要 32, 477 (1986)
- 6) 郡 健二郎ほか：泌尿紀要 32, 486 (1986)
- 7) 大山正明ほか：泌尿紀要 32, 649 (1986)
- 8) 大森弘之ほか：西日泌尿 51, 697 (1989)
- 9) 志田圭三ほか：泌尿紀要 32, 625 (1986)
- 10) 熊本悦明ほか：泌尿紀要 36, 213 (1990)
- 11) 熊本悦明ほか：泌尿紀要 36, 227 (1990)
- 12) 山中英寿ほか：泌尿紀要 29, 1133 (1983)

***【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

M S D株式会社 MSDカスタマーサポートセンター
東京都千代田区九段北1-13-12
医療関係者の方：フリーダイヤル 0120-024-961

*** 製造販売元

M S D 株式会社

東京都千代田区九段北1-13-12

販売提携

第一三共株式会社

東京都中央区日本橋本町3-5-1

®：登録商標



Daiichi-Sankyo