

※※2010年5月改訂（第3版、指定医薬品の廃止に伴う改訂）

※2008年6月改訂

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^{注1)}

前立腺肥大症治療剤

※ **デポスタット[®]筋注200mg** ※
Depostat[®] intramuscular injection
(ゲストノロンカブロン酸エステル注射液)

日本標準商品分類番号

872479

承認番号	22000AMX00347
薬価収載	2008年6月
販売開始	2005年5月
再審査結果	1989年9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）

重篤な肝障害のある患者

[症状を悪化させるおそれがある]

※【組成・性状】

販売名	デポスタット筋注200mg
成分・含量	1管（2mL）中、ゲストノロンカブロン酸エステル200mg含有
添加物	安息香酸ベンジル1218.8mg ヒマシ油適量
色・性状	無色～淡黄色澄明の油性注射液で芳香を有する

【効能・効果】

前立腺肥大症

【用法・用量】

ゲストノロンカブロン酸エステルとして、通常成人1週1回200mgを臀筋内に注射する。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

投与期間は、8～12週間を基準として以後漫然と投与を継続しないこと。

【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) 糖尿病の患者
[耐糖能の低下があらわれることがある]
- (2) 気管支喘息の患者
[症状を悪化させるおそれがある]
- (3) てんかんの患者
[症状を悪化させるおそれがある]
- (4) 片頭痛の患者
[症状を悪化させるおそれがある]
- (5) 心障害、腎障害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. 副作用

総症例3,458例中280例（8.1%）に副作用が認められた。主な副作用は注射部疼痛92件（2.7%）、性欲減退41件（1.2%）、注射部硬結29件（0.8%）、注射部痒感24件（0.7%）、発熱17件（0.5%）、食欲不振16件（0.5%）、貧血16件（0.5%）、肝機能検査異常14件（0.4%）、全身倦怠感13件（0.4%）、発疹12件（0.3%）等であった。

（再審査終了時）

下記の副作用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。

頻度 種類	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注2)}	発疹、痒痒		
肝 臓	肝機能異常		
腎 臓	BUN上昇、クレアチニン上昇		
血 液	貧血		
呼吸器	呼吸困難		咳
循環器			動悸
生殖器	性欲減退		乳腺腫脹、一過性の精子減少症
消化器	食欲不振、胃痛	嘔吐、下痢	悪心
精神神経系	全身倦怠感、脱力感	意欲減退	
投与部位	疼痛、硬結、腫脹		
その他	発熱、発汗	冷感	

注2) 投与を中止すること

3. 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、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

4. 適用上の注意

- (1) **投与経路**：臀筋内に注射すること。
- (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) **投与時**：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同一部位への反復投与を避け、左右臀筋に交互に注射すること。
- ②神経走行部位を避けるよう注意すること。
- 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。

【薬物動態】

健康男子に³H-ゲストノロンカプロン酸エステル100mg又は200mgを筋肉内に投与すると、投与後4時間で血中濃度が上昇しはじめ、最高血中濃度（223.4～319.4ng/mL）は、投与量と関係なく3日目に認められた。また、投与後1週間までに投与量の57～69%、14日目までに82～89%、28日目までに86～95%が排泄され、総排泄量の約80%が糞便中に認められた。¹⁾（外国データ）

【臨床成績】

総合改善度

二重盲検試験²⁾ 症例109例における排尿状態、排尿回数、残尿量、尿道膀胱造影、尿流計測等に関する総合改善度は下記のとおりであった。

著明改善（例数）	中等度改善（例数）	やや改善（例数）
15.6% (17/109)	23.9% (26/109)	37.6% (41/109)

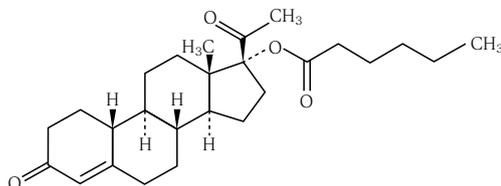
【薬効薬理】

ゲストノロンカプロン酸エステルは、主として直接前立腺に作用し、前立腺腺腫の縮小又は前立腺腺腫の成長を抑制する。すなわちゲストノロンカプロン酸エステルは、血中のテストステロンが前立腺細胞内に取り込まれるのを阻害し、さらにテストステロンが、5 α -還元酵素によって活性型5 α -DHTへ転換するのを阻害する。^{3～6)}

また、ゲストノロンカプロン酸エステルは、マイルドなゴナドトロピン分泌抑制作用も認められている。^{2,7～9)}

※【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：ゲストノロンカプロン酸エステル
(Gestonorone Caproate)

化学名：17-hydroxy-19-nor-4-pregnene-3,
20-dione hexanoate

分子式：C₂₆H₃₈O₄

分子量：414.58

融点：127～131℃

性状：本品は白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

溶解性：本品はアセトン、クロロホルム、酢酸エチル又は安息香酸ベンジルに溶けやすく、メタノール又はエタノール(99.5)にやや溶けやすく、ジエチルエーテル又はヒマシ油にやや溶けにくく、石油エーテル又はヘキサンに溶けにくく、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】

2mL 10管

【主要文献】

- 1) Kolb, K. H. : 社内資料 (1967)
- 2) 吉田 修ほか：臨床評価 8 (2) : 481 (1980)
- 3) Altwein, J. E. et al. : Dtsch. Med. Wschr. 100 (12) : 626 (1975)
- 4) Altwein, J. E. et al. : Urologe A13 : 41 (1974)
- 5) Orestano, F. et al. : Urologe A13 : 289 (1974)
- 6) Orestano, F. et al. : J. Steroid Biochem. 6 : 845 (1975)
- 7) 新島端夫ほか：泌尿器科紀要 16 (9) : 508 (1970)
- 8) 松本圭史ほか：薬物療法 11 (4) : 377 (1978)
- 9) 林 正ほか：薬物療法 11 (3) : 363 (1978)

【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

製造販売元

 **富士製薬工業株式会社**
富山県富山市水橋辻ヶ堂1515番地