

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領（1998年9月）に準拠して作成

処方せん医薬品

日本薬局方 メチルテストステロン錠

**エナルモン<sup>®</sup>錠 25mg****ENARMON<sup>®</sup> TABLETS 25mg**

剤形	素錠
規格・含量	1錠中 日局メチルテストステロン 25mg
一般名	和名：メチルテストステロン（JAN） 洋名：Methyltestosterone（JAN）
製造・輸入承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	承認年月日：2007年9月10日 薬価基準収載年月日：1970年8月1日 発売年月日：1952年1月
開発・製造・ 輸入・発売・提携・ 販売会社名	製造販売元：あすか製薬株式会社 販売：武田薬品工業株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	

## IF 利用の手引きの概要 — 日本病院薬剤師会 —

### 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MRと略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和 63 年日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、I F と略す）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成 10 年日病薬学術第 3 小委員会によって新たな位置付けと I F 記載要領が策定された。

### 2. I F とは

I F は「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な医薬品の適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F の記載事項とはならない。

### 3. I F の様式・作成・発行

規格は A 4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。I F は日病薬が策定した「I F 記載要領」に従って記載するが、本 I F 記載要領は、平成 11 年 1 月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「I F 記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合には I F が改訂・発行される。

### 4. I F の利用にあたって

I F 策定の原点を踏まえ、MR へのインタビュー、自己調査のデータを加えて I F の内容を充実させ、I F の利用性を高めておく必要がある。

MR へのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段に I F 作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

## 目 次

．概要に関する項目・・・・・・・・・・	1	4．用法・用量に関連する使用上の注意と その理由	
1．開発の経緯		5．慎重投与内容とその理由	
2．製品の特徴及び有用性		6．重要な基本的注意とその理由及び処置方法	
．名称に関する項目・・・・・・・・・・	2	7．相互作用	
1．販売名		8．副作用	
2．一般名		9．高齢者への投与	
3．構造式又は示性式		10．妊婦，産婦，授乳婦等への投与	
4．分子式及び分子量		11．小児等への投与	
5．化学名（命名法）		12．臨床検査結果に及ぼす影響	
6．慣用名，別名，略号，記号番号		13．過量投与	
7．CAS登録番号		14．適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留 意すべき必須事項等）	
．有効成分に関する項目・・・・・・・・・・	3	15．その他の注意	
1．有効成分の規制区分		16．その他	
2．物理化学的性質		．非臨床試験に関する項目・・・・・・・・・・	17
3．有効成分の各種条件下における安定性		1．一般薬理	
4．有効成分の確認試験法		2．毒性	
5．有効成分の定量法		．取扱い上の注意等に関する項目・・・・・・・・	18
．製剤に関する項目・・・・・・・・・・	5	1．有効期間又は使用期限	
1．剤形		2．貯法・保存条件	
2．製剤の組成		3．薬剤取扱い上の注意点	
3．製剤の各種条件下における安定性		4．承認条件	
4．他剤との配合変化（物理化学的変化）		5．包装	
5．混入する可能性のある夾雑物		6．同一成分・同効薬	
6．溶出試験		7．国際誕生年月日	
7．製剤中の有効成分の確認試験法		8．製造・輸入承認年月日及び承認番号	
8．製剤中の有効成分の定量法		9．薬価基準収載年月日	
9．容器の材質		10．効能・効果追加，用法・用量変更追加 等の年月日及びその内容	
10．その他		11．再審査結果，再評価結果公表年月日 及びその内容	
．治療に関する項目・・・・・・・・・・	7	12．再審査期間	
1．効能又は効果		13．長期投与の可否	
2．用法及び用量		14．厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	
3．臨床成績		15．保険給付上の注意	
．薬効薬理に関する項目・・・・・・・・・・	9	．文献・・・・・・・・・・・・・・・・・・	20
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群		1．引用文献	
2．薬理作用		2．その他の参考文献	
．薬物動態に関する項目・・・・・・・・・・	10	．参考資料・・・・・・・・・・・・・・・・・・	21
1．血中濃度の推移・測定法		主な外国での発売状況	
2．薬物速度論的パラメータ		．備考・・・・・・・・・・・・・・・・・・	22
3．吸 収		その他の関連資料	
4．分 布			
5．代 謝			
6．排 泄			
7．透析等による除去率			
．安全性(使用上の注意等)に関する項目・	13		
1．警告内容とその理由			
2．禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）			
3．効能・効果に関連する使用上の注意と その理由			



## ．概要に関する項目

### 1．開発の経緯

辜丸抽出液の有効成分として 1935 年に Laquer らによりテストステロンが単離された。同年 Ruzicka らにより、テストステロンの 17 $\alpha$  位をメチル化したメチルテストステロンが合成された。メチルテストステロンは肝臓での代謝を受けにくいいため、経口投与においてもテストステロンと同程度の男性ホルモン作用を示す。

1952 年 1 月に帝国臓器製薬（現あすか製薬）は、メチルテストステロン含有製剤をエナルモン錠として発売した。

その後、医療事故防止対策の一環とした販売名変更により、2007 年 9 月に「エナルモン錠 25mg」として承認を取得した。

### 2．製品の特徴及び有用性

経口投与で有効なテストステロン製剤である。

## ．名称に関する項目

### 1．販売名

(1) 和 名：エナルモン<sup>®</sup>錠 25mg

(2) 洋 名：ENARMON<sup>®</sup> TABLETS 25mg

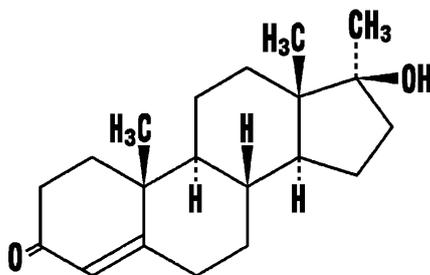
(3) 名称の由来：男性ホルモン製剤で、EnergyとHormoneより命名した。

### 2．一般名

(1) 和名（命名法）：メチルテストステロン（JAN）

(2) 洋名（命名法）：Methyltestosterone（JAN）

### 3．構造式又は示性式



### 4．分子式及び分子量

分子式：C<sub>20</sub>H<sub>30</sub>O<sub>2</sub>

分子量：302.45

### 5．化学名（命名法）

17β-Hydroxy-17α-methylandrosta-4-en-3-one（IUPAC）

### 6．慣用名，別名，略号，記号番号

該当なし

### 7．C A S登録番号

58-18-4

## ・有効成分に関する項目

### 1．有効成分の規制区分

該当しない

### 2．物理化学的性質

#### (1) 外観・性状

白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

#### (2) 溶解性

メタノール又はエタノール (95) に溶けやすく、水にほとんど溶けない。  
ジエチルエーテルにやや溶けにくい。

#### (3) 吸湿性

該当資料なし

#### (4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点

融点: 163～168℃

#### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

#### (6) 分配係数

該当資料なし

#### (7) その他の主な示性値

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ : +79 ～ +85° (乾燥後、0.1g、エタノール (95)、10mL、100mm)

### 3．有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

### 4．有効成分の確認試験法

日本薬局方「メチルテストステロン」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)

## 5．有効成分の定量法

日本薬局方「メチルテストステロン」の定量法による。  
液体クロマトグラフィー

## ・製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別及び性状

剤形	白色素錠		
	表	側面	裏
外形			
直径 6.5mm 厚さ 2.9mm 重量 100mg			

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

TZ151 (錠剤本体及び PTP の表面、裏面に表示)

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

1錠中 日局メチルテストステロンを 25mg 含有

#### (2) 添加物

カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、メチルセルロース

### 3. 製剤の各種条件下における安定性

保存条件	保存期間	保存形態	結果
室温	5年	最終包装形態	変化なし

試験項目：性状、確認試験、崩壊試験、定量

### 4. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当資料なし

### 5. 混入する可能性のある夾雑物

17 $\alpha$ -メチル-5-アンドロステン-3 $\beta$ ,17 $\beta$ -ジオール、4-アンドロステン-3,17-ジオン

## 6．溶出試験

該当資料なし

## 7．製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方「メチルテストステロン錠」の確認試験による。  
薄層クロマトグラフィー

## 8．製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方「メチルテストステロン錠」の定量法による。  
液体クロマトグラフィー

## 9．容器の材質

PTP 包装：ポリ塩化ビニル、アルミニウム箔

## 10．その他

## ・治療に関する項目

### 1．効能又は効果

男子性腺機能不全(類宦官症)、造精機能障害による男子不妊症、末期女性性器癌の疼痛緩和、手術不能の乳癌

### 2．用法及び用量

メチルテストステロンとして、男子性腺機能不全(類宦官症)には、通常、成人1日20～50mgを経口投与する。造精機能障害による男子不妊症には、通常、成人1日50mgを無精子症になるまで、経口投与する。

末期女性性器癌の疼痛緩和、手術不能の乳癌には、通常、成人1日50～200mgを経口投与する。

なお、症状により適宜増減する。

### 3．臨床成績

#### (1) 臨床効果

該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (3) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(5) 治療的使用

1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## ・薬効薬理に関する項目

### 1．薬理的に関連ある化合物又は化合物群

男性ホルモン：テストステロン、ジヒドロテストステロン、デヒドロエピアンドロステロン、アンドロステロン、アンドロステンジオン等

### 2．薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

テストステロンはヒトの主要な男性ホルモンであり、雄性動物の性器系を発育させると共に、第二次性徴の発現に関与する<sup>1)</sup>、<sup>2)</sup>。胎生期における胎児の生殖腺の男性化及び男性化徴候の発達の調節作用、雄性副性器を発達させる作用を示す。更に、筋肉の発達をもたらす蛋白同化作用、脳下垂体性ゴナドトロピンの分泌抑制作用などを有する。また、少量では睾丸の精細管に作用して造精機能を促進する。高用量では下垂体に作用して造精機序を抑制するが、投与中止によりリバウンド現象として投与前より高い精子濃度が得られるため、男子不妊症にも有効である<sup>2)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

- 1) 去勢雄性動物の前立腺、精囊等の副性器の萎縮を防止し、あるいは回復させる (ラット)<sup>3)</sup>。
- 2) 精巣の精細管に作用して精子形成を促進する<sup>4)</sup>、<sup>5)</sup>。
- 3) 脳下垂体性ゴナドトロピンの分泌を抑制する<sup>5)</sup>。
- 4) 去勢ニワトリの鶏冠を肥大発育させる<sup>6)</sup>。

## ．薬物動態に関する項目

### 1．血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間

「(3)通常用量での血中濃度」の項参照

#### (3) 通常用量での血中濃度

<参考>外国人でのデータ<sup>7)</sup>

ヒトにメチルテストステロンを単回経口投与した場合のC<sub>max</sub>、T<sub>max</sub>、T<sub>1/2</sub>、AUCの平均は以下のとおりである。

投与量	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC (ng・hr/mL)
25mg	58.1±26.9	2.1±1.02	2.44±0.69	191.6±73.4
10mg	25.5±11.7	1.65±1.08	2.49±0.60	84.8±39.2

(mean±S.D., n=10)

#### (4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

### 2．薬物速度論的パラメータ

#### (1) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (2) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

#### (3) 消失速度定数

該当資料なし

#### (4) クリアランス

該当資料なし

#### (5) 分布容積

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸 収

消化管

4. 分 布

(1) 血液 脳関門通過性

該当資料なし

(2) 胎児への移行性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

5. 代 謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

代謝部位：肝臓

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位

主に尿中より ( $17\alpha$ -methyl- $5\beta$ -androstane- $3\alpha,17\beta$ -diol と  $17\alpha$ -methyl- $5\alpha$ -androstane- $3\alpha,17\beta$ -diol として) 排泄されるが、糞中へも排泄される<sup>1), 8)</sup>。

### (2) 排泄率

該当資料なし

### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. 透析等による除去率

### (1) 腹膜透析

該当資料なし

### (2) 血液透析

該当資料なし

### (3) 直接血液灌流

該当資料なし

## ．安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1．警告内容とその理由

該当しない

### 2．禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

#### 【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  
[腫瘍の悪化あるいは顕性を促すことがある。]
- (2) 肝障害のある患者  
[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。]
- (3) 妊婦又は妊娠している可能性のある女性（「10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）

### 3．効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4．用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5．慎重投与内容とその理由

#### 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  
[前立腺肥大が増大するおそれがある。]
- (2) 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おそれがある。]
- (3) 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。]
- (4) 高齢者（「9.高齢者への投与」の項参照）
- (5) 骨成長が終了していない可能性がある患者、思春期前の患者（「11.小児等への投与」の項参照）

### 6．重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) 男性に投与する場合には、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には、変声の可能性のあることを告げておき、投与に際しては観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止すること。

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

### (2) 併用注意とその理由

【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
抗凝血剤 ワルファリンカリウム等	抗凝血剤の作用を増強することがあるので、抗凝血剤を減量するなど注意する。	本剤の凝固因子合成抑制あるいは分解促進作用による。

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

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(再審査対象外)。

#### 1) 重大な副作用と初期症状

該当しない

#### 2) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 <sup>注1)</sup>	過敏症状
肝臓 <sup>注2)</sup>	黄疸、肝機能検査値の異常
内分泌 <sup>注2)</sup> 女性	回復しがたい嗄声・多毛、痤瘡、色素沈着、月経異常、陰核肥大、性欲亢進
男性	陰茎肥大、持続性勃起、特に大量継続投与により精巣萎縮・精子減少・精液減少等の精巣機能抑制
消化器	悪心、嘔吐、食欲不振等
精神神経系	多幸症状
皮膚	脱毛、皮膚色調の変化（紅斑等）等

注 1) 発現した場合には投与を中止すること。  
注 2) 観察を十分に行い、発現した場合には減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(3) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

過敏症状が発現した場合には投与を中止すること。。

9．高齢者への投与

高齢者には慎重に投与すること。

[男性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り、また一般に高齢者では生理機能が低下している。]

10．妊婦，産婦，授乳婦等への投与

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。

[女性胎児の男性化を起こすことがある。]

11．小児等への投与

骨成長が終了していない可能性がある患者、思春期前の患者には観察を十分に行い慎重に投与すること。

[骨端の早期閉鎖，性的早熟を来すおそれがある。]

12．臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13．過量投与

該当資料なし

#### 14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

##### 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に刺入し、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）。

#### 15. その他の注意

蛋白同化・男性ホルモン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>9)～11)</sup>。

#### 16. その他

## ・非臨床試験に関する項目

### 1．一般薬理

該当資料なし

### 2．毒 性

#### (1) 単回投与毒性試験<sup>12)</sup>

LD<sub>50</sub> (mg/kg)

動 物	投与経路	経 口	皮 下	腹 腔 内
	マウス	♂	1,860	>5,000
♀		1,970	>5,000	492
ラット	♂	>2,500	>5,000	1,050
	♀	>2,500	>5,000	1,300

#### (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

#### (3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## ．取扱い上の注意等に関する項目

### 1．有効期間又は使用期限

使用期限：5年（安定性試験結果に基づく）

### 2．貯法・保存条件

室温保存

### 3．薬剤取扱い上の注意点

規制区分：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）

### 4．承認条件

該当しない

### 5．包装

30錠（10錠×3）

### 6．同一成分・同効薬

同一成分：エネルファ錠 10

同効薬：テストステロンプロピオン酸エステル、テストステロンエナント酸エステル

### 7．国際誕生年月日

不明

### 8．製造・輸入承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
エナルモン錠 25mg	2007年9月10日	21900AMX01423000
エナルモン錠（旧販売名）	1984年7月12日	15900AMZ00501000

### 9．薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日
エナルモン錠 25mg	1970年8月1日
エナルモン錠（旧販売名）	（統一名収載品のため変更なし）

10. 効能・効果追加，用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

再評価

通知年月日：1975年10月17日

再評価結果：現効能・効果、用法・用量における有用性が認められた。

12. 再審査期間

該当しない

13. 長期投与の可否

可

14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード

販売名	薬価基準収載医薬品コード
エナルモン錠 25mg	2462001F1016
エナルモン錠（旧販売名）	（統一名収載品のため変更なし）

15. 保険給付上の注意

該当なし

## . 文献

### 1 . 引用文献

- 1) 一井昭吾：臨床薬理学大系 第12巻 ホルモン， P.120（中山書店1966）
- 2) 第十五改正日本薬局方解説書, C-4318（廣川書店， 2006）
- 3) Bruni,G.et al. : Ann.Endocrinol., 25 : 469, 1964
- 4) Howard,E.J,et al. : Textbook of Endocrinology 2 Ed : 316, 341, 1955
- 5) Abderhalden,R. : Die Hormone, P.37, 1952
- 6) Dorfman,R.I.& Shipley,R.A. : Androgens:John Wiley and Sons Inc., New York, P.116, 1956
- 7) Alkalay, D., et al. : J. Clin. Pharmacd. 13 : 142, 1973
- 8) Rongone, E. L., et al. : J. Biol. Chem. 237 : 1066, 1962
- 9) 太田裕彦 他：肝臓, 18 : 958, 1977
- 10) Falk,H et al. : Lancet, II : 1120, 1979
- 11) 岡 輝明 他：病理と臨床, 6 : 337, 1988
- 12) 永井 雅代 他：J. Toxic. Sci., 1 : 90, 1976

### 2 . その他の参考文献

該当資料なし

## ・参考資料

主な外国での発売状況

該当しない

・備考

その他の関連資料

該当資料なし