

貯 法：室温保存

有効期間：3年

	錠40mg	錠80mg	カプセル40mg
承認番号	15300AMZ00255000	15300AMZ00256000	21900AMX00058000
販売開始	1978年4月	1978年4月	1969年1月

## 膵胆道・尿路系鎮痙剤

## フロプロピオン製剤

コスパン<sup>®</sup>錠40mgコスパン<sup>®</sup>錠80mgCospanon<sup>®</sup> Tablets

## 日本薬局方 フロプロピオンカプセル

コスパン<sup>®</sup>カプセル40mgCospanon<sup>®</sup> Capsules

## 3. 組成・性状

## 3.1 組成

販売名	コスパン錠 40mg	コスパン錠 80mg	コスパンカプセル 40mg
有効成分	1錠中 フロプロピオン40mg	1錠中 フロプロピオン80mg	1カプセル中 フロプロピオン40mg
添加剤	カルナウバロウ、カルメロース、含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸、ステアリン酸カルシウム、精製白糖、タルク、沈降炭酸カルシウム、トウモロコシデンプン、白色セラック、ヒドロキシプロピルセルロース、プルラン、ポビドン、マクロゴール6000	カルナウバロウ、カルメロース、含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸、ステアリン酸カルシウム、精製白糖、タルク、沈降炭酸カルシウム、トウモロコシデンプン、白色セラック、ヒドロキシプロピルセルロース、プルラン、ポビドン、マクロゴール6000	黄色5号、結晶セルロース、青色1号、赤色3号、ゼラチン、タルク、トウモロコシデンプン、ラウリル硫酸ナトリウム

## 3.2 製剤の性状

販売名	コスパン錠 40mg	コスパン錠 80mg	コスパンカプセル 40mg
剤形	糖衣錠	糖衣錠	硬カプセル剤
識別コード	€ 119	€ 120	CS40€
外形	表		
	裏		
	側面		
全長(mm)又は直径(mm)	7.0	8.6	15.9
質量(mg)	140	267	231
号数又は厚さ(mm)	4.0	4.9	3号
色	白色	白色	カプセル 上半分：暗赤色 下半分：淡黄褐色 内容物：白色～微黄褐色の粉末

## 4. 効能又は効果

下記の疾患に伴う鎮痙効果

肝胆道疾患：胆道ジスキネジー、胆石症、胆のう炎、胆管炎、胆のう剔除後遺症

膵疾患：膵炎

尿路結石

## 6. 用法及び用量

## 〈錠40mg〉

通常成人は、1回1～2錠（フロプロピオンとして1回40～80mg）を1日3回毎食後経口投与する。

泌尿器科においては、1回2錠を1日3回毎食後経口投与する。年齢、症状により適宜増減する。

## 〈錠80mg〉

通常成人は、1回1錠（フロプロピオンとして1回80mg）を1日3回毎食後経口投与する。

年齢、症状により適宜増減する。なお、尿路結石以外に対する通常の用法及び用量はフロプロピオンとして1回40～80mg 1日3回毎食後経口投与する。

## 〈カプセル40mg〉

通常成人は、1回1～2カプセル（フロプロピオンとして1回40～80mg）を1日3回経口投与する。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

## 9.1 合併症・既往歴等のある患者

## 9.1.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

## 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

## 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

## 9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

## 9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に高齢者では生理機能が低下している。

## 11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

## 11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満
消化器	悪心・嘔気、胸やけ、腹部膨満感
過敏症	発疹

注) 発現頻度は副作用発生頻度調査結果に基づく。

## 14. 適用上の注意

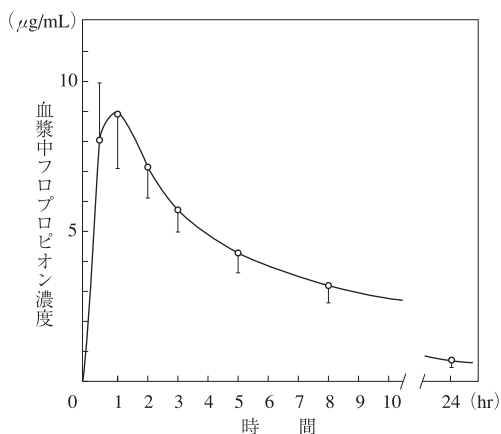
## 14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

健康成人男子12名に、コスパノンカプセル40mg 6カプセル（フロプロピオンとして240mg<sup>注</sup>）を絶食下单回経口投与し、血漿中の未変化フロプロピオン濃度を測定した。投与後1時間で最高血漿中濃度は約9 $\mu$ g/mLを示し、以後経時的に低下し、24時間後にはほとんど血漿中から消失した。



フロプロピオン240mg絶食下单回経口投与後の血漿中濃度

注) 本剤の承認された用法及び用量は「錠40mg:通常成人は、1回1~2錠（フロプロピオンとして1回40~80mg）を1日3回毎食後経口投与する。泌尿器科においては、1回2錠を1日3回毎食後経口投与する。年齢、症状により適宜増減する。」「錠80mg:通常成人は、1回1錠（フロプロピオンとして1回80mg）を1日3回毎食後経口投与する。年齢、症状により適宜増減する。なお、尿路結石以外に対する通常の用法及び用量はフロプロピオンとして1回40~80mg 1日3回毎食後経口投与する。」「カプセル40mg:通常成人は、1回1~2カプセル（フロプロピオンとして1回40~80mg）を1日3回経口投与する。」である。

## 17. 臨床成績

### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

#### 17.1.1 二重盲検試験及び一般臨床試験

慢性の腹痛、悪心、食欲不振を有する胆膵疾患を対象とした二重盲検試験で本剤の有用性が認められている<sup>1)</sup>。胆道ジスキネジー、胆石症、胆のう炎、胆のう別出後遺症、膵炎、尿路結石を対象として鎮痙効果をみた二重盲検試験及び一般臨床試験、1,036症例において、本剤の有用性が認められている。

#### 17.1.2 尿管結石排出促進効果

本剤の尿管結石排出促進効果について、自然排石群を対照群として、レトロスペクティブに比較検討した。初発症状・投薬開始から10日目以降の累積排石率は、20、30、60、90、120日の各時点とも有意に本剤投与群が高かった<sup>2)</sup>。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

COMT (Catechol-o-methyl-transferase) 阻害によるアドレナリン作動性作用と、抗セロトニン作用に基づくものとされている。

### 18.2 COMT阻害による鎮痙作用

本薬の鎮痙作用を、イス、モルモット及びラットにて検討した結果、消化管平滑筋とともに膵胆道、尿路系平滑筋の痙攣緩解作用を示した<sup>3),4)</sup>。

### 18.3 オジ筋の機能異常改善作用

本薬4、8、16、32mg/kgをイスへ静注したところ、全ての用量でオジ筋を弛緩させ、胆汁・膵液の十二指腸への排出を促進して膵胆道内圧を低下させた<sup>5)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名: フロプロピオン (Flopropione)

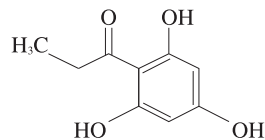
化学名: 1-(2,4,6-Trihydroxyphenyl)propan-1-one

分子式: C<sub>9</sub>H<sub>10</sub>O<sub>4</sub>

分子量: 182.17

性状: フロプロピオンは白色~微黄褐色の結晶性の粉末である。本品はN,N-ジメチルホルムアミドに極めて溶けやすく、メタノール又はエタノール(99.5)に溶けやすく、水にほとんど溶けない。

構造式:



融点: 177~181 $^{\circ}$ C

## 20. 取扱い上の注意

〈錠〉

20.1 PTP包装は外箱開封後、光を避けて保存すること。変色することがある。

〈カプセル〉

20.2 PTP包装はアルミ袋開封後、湿気を避けて保存すること。カプセル内容物が変色することがある。

## 22. 包装

〈コスパノン錠40mg〉

100錠 [10錠 (PTP) × 10]

〈コスパノン錠80mg〉

100錠 [10錠 (PTP) × 10]、1,000錠 [10錠 (PTP) × 100]

〈コスパノンカプセル40mg〉

100カプセル [10カプセル (PTP) × 10、乾燥剤入り]、1,000カプセル [10カプセル (PTP) × 100、乾燥剤入り]

## 23. 主要文献

- 1) 三好秋馬: 内科宝函, 1967; 14 (6): 79-83 [CSP-0076]
- 2) 村田庄平ら: 西日本泌尿器科, 1975; 37 (1): 157-159 [CSP-0097]
- 3) 井上俊一ら: 現代の臨床, 1967; 1 (11): 764-769 [CSP-0043]
- 4) 市河三太ら: 日本平滑筋学会雑誌, 1968; 4 (2): 151-159 [CSP-0046]
- 5) 勝井五一郎ら: 応用薬理, 1968; 3 (2): 113-119 [CSP-0048]

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

エーザイ株式会社 hhcホットライン  
〒112-8088 東京都文京区小石川4-6-10  
フリーダイヤル 0120-419-497

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

エーザイ株式会社  
東京都文京区小石川4-6-10