

※※2003年11月改訂(第3版)  
※2002年9月改訂

|             |
|-------------|
| 日本標準商品分類番号  |
| 8 7 3 1 3 6 |

|                     |
|---------------------|
| <b>貯法</b>           |
| しゃ光、室温保存            |
| <b>使用期限</b>         |
| 包装に表示の使用期限内に使用すること。 |

## 末梢性神経障害治療剤

|      |            |
|------|------------|
| 承認番号 | (47AM)2815 |
| 薬価収載 | 1981年9月    |
| 販売開始 | 1981年9月    |

# コバメチン<sup>®</sup>カプセル250

COBAMETIN<sup>®</sup> CAPSULES 250

メコバラミンカプセル

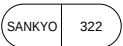
## 【組 成 ・ 性 状】

### ※※1. 組 成

**コバメチンカプセル250**：1カプセル中メコバラミン(日局)250μgを含有  
添加物として乳糖、ステアリン酸マグネシウム、酸化チタン、赤色三号、青色一号、ラウリル硫酸ナトリウム、亜硫酸水素ナトリウムを含有

### 2. 製剤の性状

暗赤紫色の硬カプセル剤(内容物はわずかに紅色を帯びた白色の粉末)

| 販売名                  | 識別コード      | 外 形 等                                                                                                                            |
|----------------------|------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| コバメチン<br>カプセル<br>250 | SANKYO 322 | <br>重さ(mg)・号数・長径(mm)・短径(mm)<br>350 3 15.8 5.8 |

## 【効 能 又 は 効 果】

末 梢 性 神 經 障 害

## 【用 法 及 び 用 量】

通常、成人は1日量6カプセル(メコバラミンとして1,500μg)を3回に分けて経口投与する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

## 【使 用 上 の 注 意】

### 1. 重要な基本的注意

効果がないのに、月余にわたって漫然と投与すべきでない。

### 2. 副作用

総症例5,227例中副作用が報告されたのは41例(0.78%)であった。その主なものは、胃部不快感(0.31%)等の消化器症状であった。  
〔新医薬品等の副作用等の使用成績の調査報告書(第4次)〕

|                   | 副作用の頻度              |          |
|-------------------|---------------------|----------|
|                   | 0.1～0.5%未満          | 0.1%未満   |
| 過敏症 <sup>注)</sup> |                     | 発疹       |
| 消化器               | 胃部不快感<br>食欲不振<br>悪心 | 下痢<br>腹痛 |

注) 投与を中止すること。

### 3. 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。)

## 4. その他の注意

水銀及びその化合物を取り扱う職業従事者に長期にわたって大量に投与することは避けることが望ましい。

## 【薬 物 動 態】

### ※※1. 血中濃度<sup>1)</sup>

頸肩腕症候群、腰痛症の患者21例にコバメチンカプセル500μgを1日3回食後経口投与したところ、投与前と比較して4週後、8週後にそれぞれ有意に血中濃度の上昇を認めた。

|       | 血中濃度(pg/mL)    |
|-------|----------------|
| 投与開始時 | 560.5±226.9    |
| 4週後   | 735.0±282.1*** |
| 8週後   | 821.1±404.0*** |

n=21、Mean±S.D.、\*\*\*p<0.001

### (参考：動物)

### 2. 分 布<sup>2)</sup>

- <sup>57</sup>Co-メコバラミンをラットに経口投与し、経時的に血中、主要臓器への取り込みを測定し、同時に<sup>57</sup>Co-シアノコバラミンと比較した結果、メコバラミンはシアノコバラミンにくらべ、肝への集積率が有意に高いことが認められている。
- 投与量の異なる種々の投与量の<sup>57</sup>Co-メコバラミン及びシアノコバラミンをラットに経口投与し、6日後の主要臓器への取り込み量等を測定した結果は、いずれの投与量においても両者間の絶対吸収量に有意差は認められていない。

## 【臨 床 成 績】

本剤の一般臨床試験は、34施設、総症例740例につき実施された。このうち効果判定が行われ、かつ本剤の適応疾患である末梢性神経障害に対する臨床効果の検討では74.6%(270/362)の有効率が得られた。投与量は1日2～6カプセル(メコバラミンとして500～1,500μg)が使用され、疾患別では帯状疱疹[有効率81.5%(66/81)]、腰痛症[80.0%(52/65)]、糖尿病性神経障害[72.6%(69/95)]、頸肩腕症候群[76.9%(20/26)]等に効果が認められた。なお、糖尿病性神経障害<sup>3,4)</sup>、腰痛症<sup>5)</sup>並びに帯状疱疹<sup>6)</sup>を対象としたinactive placeboとの二重盲検比較試験において有意にすぐれた効果が認められた。

## 【薬 効 薬 理】

### 1. 生化学的作用

- メコバラミンはB<sub>12</sub>作用の本態である補酵素型B<sub>12</sub>で、生体内のメチル基転移反応(メチオニン生成反応、酢酸生成反応、メタン生成反応)に関与することが明らかにされている<sup>7)</sup>。
- メコバラミンはメチオニン生成反応を通じて貯蔵型葉酸の利用を促進する<sup>8)</sup>と共に、t-RNAのメチル化<sup>9)</sup>など核酸代謝にも直接関与している。
- リン脂質代謝にも関与しており、ビタミンB<sub>12</sub>欠乏ラットに<sup>14</sup>C-メコバラミンを投与した場合、神経系のレシチン分画への<sup>14</sup>C取り込みの増加がみられたという報告がある<sup>10)</sup>。

### ※※2. 神経組織に対する作用<sup>7,11,12)</sup>

ビタミンB<sub>12</sub>は神経細胞の保持に必須のビタミンで、欠乏により末梢性神経障害などの神経障害をおこすことが知られている。

実験的には神経細胞内核酸合成、髄鞘形成の促進効果、コリン欠乏食により低下した脳内アセチルコリン量の正常化が報告されている(ラット)。

#### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：メコバラミン(Mecobalamin)

※化学名：Co $\alpha$ -[ $\alpha$ -(5,6-Dimethylbenz-1*H*-imidazol-1-yl)]-Co $\beta$ -methylcobamide

分子式：C<sub>63</sub>H<sub>91</sub>CoN<sub>13</sub>O<sub>14</sub>P

※分子量：1344.38

※性 状：暗赤色の結晶又は結晶性の粉末である。

水にやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくく、アセトニトリルにほとんど溶けない。

光によって変化する。

#### 【 包 装 】

コバメチンカプセル250 100カプセル(PTP)  
1,000カプセル(PTP・缶)  
3,000カプセル(PTP)

#### 【主要文献】

- ※※1)山岡賢児ほか：Prog. Med. 5, 470 (1985)
- 2)奥田邦雄ほか：ビタミン 40, 224 (1969)
- 3)百瀬元大ほか：診療と保険 12, 550 (1970)
- 4)森脇 健：診療と新薬 7, 17 (1970)
- 5)松森 茂：臨牀と研究 47, 948 (1970)
- 6)倉持正雄ほか：診療と新薬 7, 259 (1970)
- ※※7)田中信夫ほか：臨床成人病 14, 41 (1984)
- 8)高久史磨：最新医学 24, 727 (1969)
- 9)Walerych, W. S. et al.: B. B. R. C. 23, 368 (1966)
- 10)中沢恒幸：ビタミン 45, 354 (1972)
- 11)米沢 猛：生体の科学 22, 230 (1971)
- ※※12)Sasaki, H et al.: Pharmacol. Biochem. Behav., 43, 635 (1992)

#### 【文献請求先】

三共株式会社 製品情報部カスタマーサービスセンター  
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3-5-1



製造販売元

**三共株式会社**

SANKYO

東京都中央区日本橋本町 3-5-1

電話 03(5255)7111(大代表)

2-1