

(新聞発表用)

| | | |
|---|-------|--|
| 1 | 販売名 | ルナベル配合錠 |
| 2 | 一般名 | ノルエチステロン、エチニルエストラジオール |
| 3 | 申請者名 | ノーベルファーマ株式会社 |
| 4 | 成分・含量 | 1錠中ノルエチステロン 1mg 及びエチニルエストラジオール 0.035mg 含有 |
| 5 | 用法・用量 | 1日1錠を毎日一定の時刻に21日間経口投与し、その後7日間休薬する。 以上28日間を投与1周期とし、出血が終わっているか続いているかにかかわらず、29日目から次の周期の錠剤を投与し、以後同様に繰り返す。 |
| 6 | 効能・効果 | 子宮内膜症に伴う月経困難症 |
| 7 | 備考 | 本剤は、卵胞ホルモン・黄体ホルモン混合製剤である。 |

子宮内膜症に伴う月経困難症治療剤

指定医薬品、処方せん医薬品⁽¹⁾ルナベル[®]配合錠

LUNABELL tablets

ノルエチステロン・エチニルエストラジオール製剤

日本標準商品分類番号

872482

| | |
|------|--|
| 承認番号 | |
| 薬価収載 | |
| 販売開始 | |
| 国際誕生 | |




貯法: 遮光・気密容器・室温保存
使用期限: 外箱に表示

注) 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)】

1. 本剤の成分に対し過敏性素因のある患者
2. エストロゲン依存性腫瘍(例えば乳癌、子宮体癌)、子宮頸癌及びその疑いのある患者[腫瘍の悪化あるいは顕性化を促すことがある。]
3. 診断の確定していない異常性器出血のある患者[性器癌の疑いがある。出血が性器癌による場合は、癌の悪化あるいは顕性化を促すことがある。]
4. 血栓性静脈炎、肺塞栓症、脳血管障害、冠動脈疾患又はその既往歴のある患者[血液凝固能が亢進され、これらの症状が増悪することがある。]
5. 35歳以上で1日15本以上の喫煙者[心筋梗塞等の心血管系の障害が発生しやすくなるとの報告がある。]
6. 前兆(閃輝暗点、星型閃光等)を伴う片頭痛の患者[前兆を伴う片頭痛の患者は前兆を伴わない患者に比べ脳血管障害(脳卒中等)が発生しやすくなるとの報告がある。]
7. 肺高血圧症又は心房細動を合併する心臓弁膜症の患者、亜急性細菌性心内膜炎の既往歴のある心臓弁膜症の患者[血栓症等の心血管系の障害が発生しやすくなるとの報告がある。]
8. 血管病変を伴う糖尿病患者(糖尿病性腎症、糖尿病性網膜症等)[血栓症等の心血管系の障害が発生しやすくなるとの報告がある。]
9. 血栓性素因のある患者[血栓症等の心血管系の障害が発生しやすくなるとの報告がある。]
10. 抗リン脂質抗体症候群の患者[血栓症等の心血管系の障害が発生しやすくなるとの報告がある。]
11. 手術前4週以内、術後2週以内、産後4週以内及び長期間安静状態の患者[血液凝固能が亢進され、心血管系の副作用の危険性が高くなる可能性がある。(「重要な基本的注意」(2)の項参照)]
12. 重篤な肝障害のある患者[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。]
13. 肝腫瘍のある患者[症状が増悪することがある。]
14. 脂質代謝異常のある患者[血栓症等の心血管系の障害が発生しやすくなるとの報告がある。また、脂質代謝に影響を及ぼす可能性があるため、症状が増悪することがある。]
15. 高血圧のある患者(軽度の高血圧の患者を除く)[血栓症等の心血管系の障害が発生しやすくなるとの報告がある。また、症状が増悪することがある。]
16. 耳硬化症の患者[症状が増悪することがある。]
17. 妊娠中に黄疸、持続性そう痒症又は妊娠ヘルペスの既往歴のある患者[症状が再発するおそれがある。]
18. 妊婦又は妊娠している可能性のある患者(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
19. 授乳婦(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
20. 思春期前の患者[骨端の早期閉鎖を来すおそれがある。]

【組成・性状】

| 販売名 | | ルナベル配合錠 | |
|-------|----|--|--|
| 成分・含量 | | 1錠中ノルエチステロン(日局)1mg及びエチニルエストラジオール(日局)0.035mg含有 | |
| 添加物 | | 無水乳糖、乳糖水和物、部分アルファー化デンプン、ステアリン酸マグネシウム | |
| 剤形 | | 錠剤(素錠) | |
| 色 | | 白色 | |
| 外形 | | 表面  裏面  側面  | |
| 大きさ | 直径 | 6.5mm | |
| | 厚さ | 2.2mm | |
| | 重量 | 100mg | |
| 識別コード | | NPC31 | |

【効能・効果】

子宮内膜症に伴う月経困難症

【用法・用量】

1日1錠を毎日一定の時刻に21日間経口投与し、その後7日間休薬する。以上28日間を投与1周期とし、出血が終わっているか続いているかにかかわらず、29日目から次の周期の錠剤を投与し、以後同様に繰り返す。

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

1. 毎日一定の時刻に服用させること。
2. 本剤の投与にあたっては飲み忘れ等がないよう服用方法を十分指導すること。
3. 初めて服用させる場合、原則として月経第1～5日に服用を開始させること。
4. 万一前日の飲み忘れに気付いた場合、直ちに前日の飲み忘れた錠剤を服用し、当日の錠剤も通常の服薬時刻に服用する。2日以上服薬を忘れた場合は、気付いた時点で前日分の1錠を服用し、当日の錠剤も通常の服薬時刻に服用し、その後は当初の服薬スケジュールとおりに服用を継続すること。

【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) 子宮筋腫のある患者[筋腫の腫大を促すことがあるので、定期的には内診や画像診断等の検査を行うなど慎重に投与すること。]
 - (2) 40歳以上の患者[一般に心筋梗塞等の心血管系の障害が発生しやすくなる年代であるため、これを助長するおそれがある。]
 - (3) 乳癌の家族歴又は乳房に結節のある患者[エストロゲン投与と乳癌発生との因果関係についてその関連性を示唆する報告もあるので、定期的には乳房検診を行うなど慎重に投与すること。]

- (4)喫煙者(「禁忌」の項参照)
- (5)肥満の患者[血栓症等の心血管系の障害が発生しやすくなるとの報告がある。]
- (6)血栓症の家族歴を持つ患者[血栓症等の心血管系の障害が発生しやすくなるとの報告がある。]
- (7)前兆を伴わない片頭痛の患者[脳血管障害(脳卒中等)が発生しやすくなるとの報告がある。]
- (8)心臓弁膜症の患者(「禁忌」の項参照)
- (9)軽度の高血圧(妊娠中の高血圧の既往も含む)のある患者(「禁忌」の項参照)
- (10)耐糖能の低下している患者(糖尿病患者及び耐糖能異常の患者)[耐糖能が低下することがあるので、十分コントロールを行いながら投与すること。]
- (11)ポルフィリン症の患者[症状が増悪することがある。]
- (12)肝障害のある患者(「禁忌」の項参照)
- (13)心疾患、腎疾患又はその既往歴のある患者[ナトリウム又は体液の貯留により症状が増悪することがある。]
- (14)てんかん患者[症状が増悪することがある。]
- (15)テタニーのある患者[症状が増悪することがある。]

2. 重要な基本的注意

- (1)本剤の服用により、**血栓症**があらわれることがあるので、次のような症状・状態があらわれた場合には投与を中止すること。また、本剤服用患者に対しては、次のような症状・状態が認められた場合には直ちに医師等に相談するよう、あらかじめ説明すること。
 - 1)血栓症の初期症状
下肢の疼痛・浮腫、突然の息切れ、胸痛、激しい頭痛、急性視力障害等
 - 2)血栓症のリスクが高まる状態
体を動かさない状態、顕著な血圧上昇がみられた場合等
- (2)本剤服用中にやむを得ず手術が必要と判断される場合には、血栓塞栓症の予防に十分配慮すること。
- (3)**年齢及び喫煙量**により心血管系の重篤な副作用の危険性が増大するとの報告があるので、本剤服用患者には**禁煙**するよう指導すること。(「禁忌」の項参照)
- (4)本剤の投与に際しては患者の病歴調査及び検診が必要である。この検診には、血圧測定、乳房・腹部の検査及び臨床検査が含まれる。
- (5)乳癌の検査は、患者に自己検診を行うよう指導すること。特に、乳癌の家族歴又は乳房に結節のある患者では注意が必要である。
- (6)卵巣チョコレート嚢胞は、頻度は低いものの自然経過において悪性化を示唆する報告があるので、本剤の投与に際しては、定期的に画像診断や腫瘍マーカー等の検査を行い、患者の状態に十分注意すること。本剤投与中に腫瘍が増大したり、臨床症状の改善がみられない場合は投与を中止すること。
- (7)本剤投与中は経過を十分に観察し、期待する効果が得られない場合には漫然と投与を継続せず、他の適切な治療を考慮すること。
- (8)長期投与を行う場合は、**6カ月毎の検診**、また、1年に1回、子宮・卵巣を中心とした骨盤内臓器の検査、特に、子宮頸部の細胞診の実施を考慮すること。
- (9)本剤の1年を超える投与における有効性及び安全性は確立していないので、1年を超える投与は治療上必要と判断される場合にのみ行い、定期的に画像診断及び臨床検査(血液検査等)を行うなど、患者の状態に十分注意すること。

- (10)服用中に不正性器出血が発現した場合、通常は投与継続中に消失するが、長期間持続する場合は、腔細胞診等の検査で悪性疾患によるものではないことを確認の上、投与すること。
- (11)本剤の投与に際しては、問診、内診、基礎体温の測定、免疫学的妊娠診断等により、妊娠していないことを十分に確認すること。
- (12)本剤投与により希発月経等の月経異常や不正出血が見られる。患者にはあらかじめ十分に説明し、通常は月経に比べて出血量が多く持続日数が長い場合あるいは月経の発来がない場合には、医師へ相談するよう指導すること。出血が続く患者には必要に応じて血液検査等を実施し、異常が認められた場合には鉄剤の投与又は本剤の投与中止など適切な処置を行うこと。
- (13)服用中に消退出血が2周期連続して発来しなかった場合、投与継続に先だつて妊娠していないことを確認すること。
- (14)服用中に激しい下痢、嘔吐が続いた場合には本剤の吸収不良をきたすことがあり、妊娠する可能性が高くなるので注意すること。
- (15)妊娠を希望する場合には、本剤の服用を中止後に月経周期が回復するまで避妊させることが望ましい。

3. 相互作用

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 |
|--|---|---|
| 副腎皮質ホルモン プレドニゾン等 二環系抗うつ剤 イミプラミン等 塩酸セレギリン シクロスポリン | これらの薬剤の作用が増強するおそれがある。 | 本剤はこれらの薬剤の代謝を抑制すると考えられる。 |
| グアネチジン硫酸塩 | グアネチジン硫酸塩の降圧作用が減弱されるおそれがある。 | 機序は明らかではないが、本剤のレニン・アンギオテンシン系への影響によるものと考えられる。 |
| リファンピシン バルビツール酸系製剤 フェノバルビタール等 ヒダントイン系製剤 フェニトインナトリウム等 カルバマゼピン グリセオフルビン テトラサイクリン系抗生物質 テトラサイクリン等 ペニシリン系抗生物質 アンピシリン等 | 本剤の効果の減弱化及び不正性器出血の発現率が増大するおそれがある。 | これらの薬剤は肝の薬物代謝酵素を誘導し、本剤の代謝を促進すると考えられる。 これらの薬剤は腸内細菌叢を変化させ、本剤の腸肝循環による再吸収を抑制すると考えられる |
| 塩酸テルピナフィン | 黄体ホルモン・卵巣ホルモン配合剤との併用で、月経異常があらわれたとの報告がある。 | 機序不明 |
| Gn-RH誘導体 酢酸ブセレリン等 | これらの薬剤の作用を減弱するおそれがある。 | これらの薬剤は性ホルモンの分泌を低下することにより薬効を示すため、性ホルモンである本剤の投与によってこれらの薬剤の効果を減弱する可能性が考えられる。 |
| 血糖降下剤 インスリン製剤 スルフォニル尿素系製剤 スルフォンアミド系製剤 ビグアナイド系製剤等 | 血糖降下剤の作用が減弱するおそれがある。血糖値その他患者の状態を十分観察し、血糖降下剤の用量を調節する等注意する。 | 本剤は耐糖能を低下させ、血糖降下剤の作用を減弱させると考えられる |

| | | |
|--|--|---|
| HIV 感染症治療薬 メシル酸ネルフィ ナビル リトナビル ネビラピン | 本剤の作用が减弱する おそれがある。 | エチニルエストラ ジオールの AUC が減少する。 |
| ボセンタン | 本剤の作用が减弱する おそれがある。 | 機序不明 |
| セイヨウオトギリソウ (St. John's Wort、 セント・ジョーンズ・ ワート) 含有食品 | 本剤の効果の减弱化及 び不正性器出血の発現 率が增大するおそれ があるので、本剤投与時 はセイヨウオトギリソウ 含有食品を摂取しないよう 注意すること。 | この食品は肝の薬 物代謝酵素を誘 導し、本剤の代謝 を促進すると考え られる。 |

4. 副作用

臨床試験では198症例に投与され、副作用(臨床検査値異常を含む)は、全解析対象例(198例)の87.9%(174例)に認められた。主なものは不正性器出血117例(59.1%)、悪心52例(26.3%)、頭痛32例(16.2%)、希発月経29例(14.6%)、上腹部痛17例(8.6%)、乳房不快感16例(8.1%)、月経過多14例(7.1%)であった。(承認時)

(1) 重大な副作用

- 1) **血栓症(頻度不明¹⁾)**: 血栓症(四肢、肺、心、脳、網膜等)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、下肢の疼痛・浮腫、突然の息切れ、胸痛、激しい頭痛、急性視力障害等の初期症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) **アナフィラキシー様症状(頻度不明¹⁾)**: アナフィラキシー様症状(呼吸困難、蕁麻疹、血管浮腫、そう痒感等)があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

| | 5%以上 | 0.1~5%未満 | 頻度不明 ¹⁾ |
|-----------------------|-----------------------------|---|----------------------|
| 過敏症 ¹⁾²⁾ | | 発疹 | |
| 眼 ¹⁾³⁾ | | 霧視 | 網膜血流障害による視力障害 |
| 肝臓 ¹⁾³⁾ | | 肝機能異常、γ-GTP 増加 | 黄疸 |
| 電解質代謝 ¹⁾³⁾ | | 浮腫、体重増加、体重減少 | |
| 卵巣 | | 出血性卵巣嚢胞、卵巣新生物、卵巣嚢胞 | |
| 子宮 | 不正性器出血(破綻出血、点状出血)、希発月経、月経過多 | 下腹部痛、無月経、不規則月経、性器分泌物、過少月経、頻発月経、子宮肥大、消退出血不規則、性交出血 | 経血量の変化、帯下の増加 |
| 乳房 | 乳房痛、乳房不快感 | 乳房緊満感、乳房萎縮、乳汁分泌、乳癌、乳房腫瘍、乳汁漏出症、線維嚢胞性乳腺疾患、乳腺線維線種 | |
| 循環器 | | 血圧上昇、動悸、ほてり、末梢性浮腫 | |
| 消化器 | 悪心、上腹部痛 | 嘔吐、腹痛、下痢、便秘、胃痛、腹部膨満、鼓腸、胃炎、過敏性腸症候群、胃不快感、菌痛、排便痛、消化管運動障害、口内炎、食欲不振、痔核 | 口渇、胸やけ、食欲亢進 |
| 精神神経系 | 頭痛 | 倦怠感、めまい、いらいら感、ふらつき、感覚鈍麻、嗅覚錯認、眠気、不眠症、感情不安定、顔面感覚鈍麻、片頭痛 | 神経過敏、頭重 |
| 皮膚 | | ざ瘡、湿疹、蕁麻疹、多形紅斑、アトピー性皮膚炎、女性陰部そう痒症、 | 色素沈着 ¹⁾⁴⁾ |

| | | | |
|-----|--|--|-----------|
| | | アレルギー性鼻炎、紅斑、そう痒症 | |
| その他 | | 性欲減退、下肢痛、熱感、胸部不快感、異常感、炎症性疼痛、背部痛、貧血、帯状疱疹、副鼻腔炎、尿道炎、黴菌、カンジダ症、鼻炎、髄膜腫、発熱、プラスミノーゲン増加、血中トリグリセリド増加、血中コレステロール増加 | 高脂血症、しびれ感 |

注1: 同一成分・分量の製剤の添付文書内容に基づき記載

注2: 投与を中止すること

注3: 投与を中止するなど適切な処置を行うこと

注4: 長時間太陽光を浴びないように注意すること

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦には投与しないこと。
- (2) 妊娠が確認された場合には投与を中止すること。なお、2周期連続して消退出血が発来しなかった場合、妊娠している可能性があるため、妊娠の有無について確認すること。[妊娠中の服用に関する安全性は確立されていない。]
- (3) 授乳中の患者には投与しないこと。[母乳の量的質的低下が起こることがある。また、母乳中への移行、児において黄疸、乳房腫大が報告されている。]

6. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立されていない(使用経験がない)。

7. 臨床検査結果に及ぼす影響

含有するエチニルエストラジオールの作用による血清蛋白(コルチコイド結合性グロブリン、サイロキシン結合性グロブリン等)の増加により、総コルチゾール、総 T3、総 T4 の上昇がみられることがある。また、これらの遊離型は変化しないとされている。これら検査値の判定に際しては注意すること。

8. 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。]

9. その他の注意

- (1) 外国の疫学調査の結果、静脈血栓症のリスクは、経口避妊薬を服用している女性は服用していない女性に比し、3.25~4.0 倍高くなるとの報告がある。また、静脈血栓症のリスクは経口避妊薬服用開始の最初の1年間に於いて最も高くなるとの報告がある。
- (2) 外国での疫学調査の結果、経口避妊薬の服用により乳癌及び子宮頸癌になる可能性が高くなるとの報告がある。
- (3) 外国で、経口避妊薬を2年以上服用した場合、良性肝腫瘍が10万人当たり3.4人発生するとの報告がある。また、腫瘍の破裂により腹腔内出血を起こす可能性がある。一方、悪性肝腫瘍(肝癌)の発生率は極めて低く、100万人当たり1人に満たない。
- (4) 卵巣ホルモン剤を妊娠動物(マウス)に投与した場合、児の成長後膈上皮及び子宮内膜の悪性変性を示唆する結果が報告されている。また、新生児(マウス)に投与した場合、児の成長後膈上皮の悪性変性を認めたとの報告がある。
- (5) 外国で、経口避妊薬の服用により全身性エリテマトーデス(SLE)の悪化、溶血性尿毒症症候群(HUS)があらわれたとの報告がある。

(6)外国で、経口避妊薬の服用による角膜厚の変化等によりコンタクトレンズがうまく調整されないため、視力・視野の変化、装用時の不快感等がみられたとの報告がある。

【薬物動態】

1. 吸収・血中濃度

(1)単回投与¹⁾

健康成人女性 29 例への本剤(ノルエチステロン 1mg、エチニルエストラジオール 0.035mg)単回投与時の薬物動態パラメータは、以下のとおりであった。(n=29、平均値±標準偏差)

| | C _{max} (ng/mL) | t _{max} (hr) | t _{1/2} (hr) | AUC ₀₋₂₄ (ng·h/mL) |
|------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|----------------------------------|
| ノルエチステロン | 12.4 ±4.4 | 1.7 ±1.0 | 6.8 ±1.13 | 75.2 ±34.1 |
| エチニルエスト ラジオール | 0.094 ±0.031 | 1.4 ±0.5 | 9.3 ±3.7 | 0.923 ±0.357 |

(2)反復投与²⁾

健康成人女性 9 例に本剤と同成分・含量の薬剤を 21 日間反復投与した場合の薬物動態パラメータは、以下のとおりであった。(n=9、平均値±標準偏差)

| | C _{max} (ng/mL) | t _{max} (hr) | t _{1/2} (hr) | AUC ₀₋₂₄ (ng·h/mL) |
|------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|----------------------------------|
| ノルエチステロン | 22.4 ±11.1 | 2.6 ±3.7 | 9.7 ±2.2 | 175.7 ±51.3 |
| エチニルエスト ラジオール | 0.172 ±0.052 | 1.3 ±1.0 | 12.5 ±2.7 | 1.999 ±0.455 |

2. 代謝³⁾

ノルエチステロンは主にステロイド骨格中の A 環の還元により代謝され、その後硫酸抱合あるいはグルクロン酸抱合を受ける。エチニルエストラジオールは肝ミクロゾーム代謝酵素によって不活性代謝物へ変換され、その後硫酸抱合、あるいはグルクロン酸抱合を受ける(ヒト)。

3. 排泄⁴⁾

ノルエチステロン及びエチニルエストラジオールは主に胆汁を経由して、糞中に排泄された(ラット)。

【臨床成績】

1. 第Ⅲ相比較試験(プラセボ対照二重盲検試験)⁵⁾

子宮内膜症に伴う月経困難症患者(本剤群:21~44歳、平均31.7歳、プラセボ群:20~48歳、平均31.5歳)を対象とした4周期投与のプラセボ対照比較試験において、本剤は月経困難症スコア合計^{注1)}の変化量でプラセボに対して有意差(2標本t検定:p<0.0001)が認められた。(平均値±標準偏差)

| | ベースライン (-1周期) | 最終観察周期 (4周期投与後又は中止時) |
|------|------------------|-------------------------|
| 本剤 | 4.4±1.12 (n=49) | 2.4±1.43 (n=49) |
| プラセボ | 4.3±1.02 (n=47) | 3.7±1.27 (n=47) |

2. 長期投与試験⁶⁾

子宮内膜症に伴う月経困難症患者(18~45歳、平均30.6歳)を対象とした、本剤13周期投与の長期投与試験における月経困難症スコア合計^{注1)}の推移は以下のとおりであった。(平均値±標準偏差)

| ベースライン (-1周期) | 1周期 投与後 | 3周期 投与後 | 6周期 投与後 | 9周期 投与後 | 13周期 投与後 |
|-------------------------|-------------------------|-------------------------|-------------------------|-------------------------|-------------------------|
| 4.3 ±0.99 (n=123) | 2.7 ±1.90 (n=123) | 2.1 ±1.67 (n=121) | 1.8 ±1.61 (n=115) | 1.5 ±1.64 (n=107) | 1.5 ±1.64 (n=107) |

注1:月経困難症スコア合計(月経困難症の程度+鎮痛薬の使用)

| | 程度 | 内容 | スコア |
|----------|-----|---------------------------------|-----|
| 月経困難症の程度 | なし | なし | 0 |
| | 軽度 | 仕事(学業・家事)に若干の支障あり | 1 |
| | 中等度 | 横になって休憩したくなるほど仕事(学業・家事)への支障をきたす | 2 |
| 鎮痛薬の使用 | 軽度 | 直前(あるいは現在)の月経期間中に、鎮痛薬を1日使用した | 1 |
| | 中等度 | 直前(あるいは現在)の月経期間中に、鎮痛薬を2日使用した | 2 |
| | 重度 | 直前(あるいは現在)の月経期間中に、鎮痛薬を3日以上使用した | 3 |

【薬効薬理】

本剤に含有されるノルエチステロンはプロゲステロン受容体に対してプロゲステロンの 2.45 倍の相対結合親和力を示し、エチニルエストラジオールはエストロゲン受容体に対して 17β-エストラジオールの 1.10 倍の相対結合親和力を示した(ウサギ)⁷⁾。本剤は脳下垂体に作用してゴナドトロピン(卵巣刺激ホルモン、黄体形成ホルモン)の分泌を抑制し、これらホルモンに依存する卵胞の発育を阻害することにより排卵を抑制した(ラット、ウサギ)⁷⁾(ヒト)⁸⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

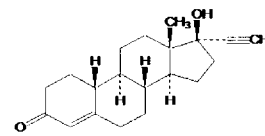
一般名:ノルエチステロン(JAN)、Norethisterone(JAN、INN)

化学名:17-Hydroxy-19-nor-17α-pregn-4-en-20-yn-3-one

分子式:C₂₀H₂₆O₂

分子量:298.42

構造式:



性状:白色〜微黄白色の結晶性の粉末で、においはない。

クロロホルムにやや溶けやすく、エタノール(95)又はテトラヒドロフランにやや溶けにくく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

融点:203~209℃

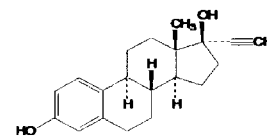
一般名:エチニルエストラジオール(JAN)、Ethinylestradiol(JAN、INN)

化学名:17α-Ethinylestra-1,3,5(10)-triene-3,17β-diol

分子式:C₂₀H₂₄O₂

分子量:296.40

構造式:



性状:白色〜微黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

ピリジン又はテトラヒドロフランに溶けやすく、エタノール(95)又はジエチルエーテルにやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。水酸化ナトリウム試液に溶ける。

融点:180~186℃又は142~146℃

【包装】

PTP 210錠(21錠×10)、84錠(21錠×4)

【主要文献】

- 社内資料(健康成人女性への単回投与後の血中濃度検討)。
- 社内資料(臨床第Ⅰ相試験-反復投与試験)。
- Orme ML, E, et al. Clin Pharmacokinet.1983;8:95-136.
- 百瀬裕子, 他. 基礎と臨床 1990;24:4841-4872.
- Harada T, et al. Fertil Steril.(掲載予定)。
- 社内資料(第Ⅲ相長期投与臨床試験)。
- Phillips A, et al. 基礎と臨床 1990;24:4789-4808.
- Nuttall ID, et al. Contraception 1982;25:463-469.

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

ノーベルファーマ株式会社 医薬情報部

〒103-0024 東京都中央区日本橋小舟町12番地10

電話 03-5651-1160

製造販売元 ノーベルファーマ株式会社

〒103-0024 東京都中央区日本橋小舟町12番地10

©:ノーベルファーマ株式会社 登録商標