

エストリオール製剤
処方箋医薬品^{注)}

エストリール錠0.5mg

ESTRIEL VAGINAL Tab. 0.5mg

(エストリオール・錠)


貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示
注)注意 一医師等の処方箋により使用すること

承認番号	22000AMX01387000
薬価収載	2008年6月
販売開始	1961年9月
再評価結果	1975年3月

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

1. エストロゲン依存性悪性腫瘍(例えば、乳癌、子宮内膜癌)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。]
2. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
3. 妊婦又は妊娠している可能性のある女性(「妊婦・産婦・授乳婦等への投与」の項参照)

【組成・性状】

販売名	エストリール錠0.5mg
成分・含量	1錠中 日局 エストリオール 0.5mg
添加物	酒石酸 炭酸水素ナトリウム バレイショデンブ ステアリン酸マグネシウム 乳糖水和物
色調・剤形	白色・素錠(発泡錠)
外形(mm)	
重量(mg)	300
識別コード	M0204

【効能・効果】

膣炎(老人、小児及び非特異性)、子宮頸管炎並びに子宮腔部びらん

【用法・用量】

エストリオールとして、通常成人1日1回0.5~1.0mgを膣内に挿入する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

【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) 乳癌の既往歴のある患者[乳癌が再発するおそれがある。]
 - (2) 乳癌家族素因が強い患者、乳房結節のある患者、乳腺症の患者又は乳房レントゲン像に異常がみられた患者[症状が増悪するおそれがある。]
 - (3) 未治療の子宮内膜増殖症のある患者[子宮内膜増殖症は細胞異型を伴う場合があるため。]

- (4) 子宮筋腫のある患者[子宮筋腫の発育を促進するおそれがある。]
- (5) 子宮内膜症のある患者[症状が増悪するおそれがある。]
- (6) 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(「小児等への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

定期的に婦人科的検査(乳房を含めて)等を実施すること。

※※ 3. 副作用

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。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

1) ショック、アナフィラキシー

ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、発疹、潮紅、呼吸困難、血圧低下等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

2) 血栓症

卵胞ホルモン剤の長期連用により、血栓症が起こることが報告されている¹⁾。

(2) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症	発疹等 ²⁾
乳房	乳房痛、乳房緊満感等

注)このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

4. 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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。なお、経口投与による動物実験(ラット)において、着床障害が認められている。]

5. 小児等への投与

卵胞ホルモン剤の投与により骨端の早期閉鎖、性的早熟をきたすおそれがあるので、骨成長が終了していない可能性がある患者、思春期前の患者に投与する場合には、観察を十分に行い、慎重に投与すること。

6. 適用上の注意

(1) 投与経路

本剤は膣内に投与すること。

(2) 投与方法

生理的月経の発現に障害を及ぼすような投与を避けること。

7. その他の注意

- (1) 卵胞ホルモン剤を長期間(約1年以上)使用した閉経期以降の婦人では、子宮内膜癌を発生する危険度が対照群の婦人に比較して高く、この危険度の上昇は使用期間、使用量と相関性があることを示唆する疫学調査の結果が報告されている²⁻⁴⁾。
- (2) 卵胞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癌性変性を示唆する結果が報告されている^{5,6)}。また、新生児に投与した場合、児の成長後、膈上皮の癌性変性を認めたとの報告がある⁷⁾。

【薬効薬理】

1. エストロゲンの作用機序

卵巣から分泌されたエストロゲンは血流を介して標的細胞に入り、エストロゲンレセプターと特異的に結合して標的細胞内に集められる。このエストロゲンレセプターとの結合物は細胞質内で活性化されて核内に入り、核を活性化してm-RNA、次いで特定の蛋白を生合成して女性ホルモンとしての作用を発現する⁸⁾。

2. 子宮及び膈に対する作用

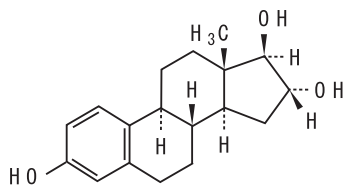
- (1) 子宮体部に対するエストリオールの作用はエストラジオールに比べてはるかに弱い(ラット)⁹⁾、頸管粘液の分泌増加や子宮口開大等の作用は強く、エストラジオールが主として子宮体部に作用するのに対し、エストリオールは子宮頸部及び膈に選択的に作用する(ヒト)^{10,11)}。
- (2) エストリオールはエストロゲンの分泌不足による膈の自浄作用の低下を回復させ、膈粘膜細胞の角化を促進し、炎症に対する膈の抵抗力を強める¹²⁾。
- (3) エストリオールは他のエストロゲンとともに少量用いると、相手のエストロゲン作用を抑制する“anti-estrogenic”作用を有する(マウス)¹³⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エストリオール(Estriol)

化学名：Estra-1, 3, 5(10)-triene-3, 16 α , 17 β -triol

構造式：



分子式：C₁₈H₂₄O₃

分子量：288.38

性状：エストリオールは白色の結晶性の粉末で、においはない。本品はメタノールにやや溶けにくく、エタノール(95)又は1,4-ジオキサンに溶けにくく、水又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

融点：281~286℃

【包装】

SP：100錠

【主要文献】

- 1) 伊藤昭夫：臨床婦人科産科 24(8), 86-88(1970)
- 2) Ziel, H. K. et al. : N. Engl. J. Med. 293(23), 1167-1170(1975)
- 3) Smith, D. C. et al. : N. Engl. J. Med. 293(23), 1164-1167(1975)
- 4) Mack, T. M. et al. : N. Engl. J. Med. 294(23), 1262-1267(1976)

- 5) 安田佳子 他：医学のあゆみ 98(8), 537-538(1976)
- 6) 安田佳子 他：医学のあゆみ 99(8), 611-612(1976)
- 7) 守 隆夫：医学のあゆみ 95(11), 599-602(1975)
- 8) 松本圭史：日本医事新報 3034, 126-127(1982)
- 9) Sealey, J. L. et al. : Endocrinology 29, 356-362(1941)
- 10) Puck, A. et al. : Dtsch. Med. Wochenschr. 82, 1864-1866(1957)
- 11) Puck, A. et al. : Geburtshilfe Frauenheilkd. 18, 998-1003(1958)
- 12) 梅原千治 他：ステロイドホルモン；Ⅲ 卵胞ホルモン, 175, 南江堂(1966)
- 13) Wicks, A. E. et al. : Proc. Soc. Exp. Biol. Med. 93, 270-273(1956)

※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

持田製薬株式会社 <すり相談窓口>
東京都新宿区四谷1丁目7番地 〒160-8515
TEL 03-5229-3906 0120-189-522
FAX 03-5229-3955

N26D

製造販売元



持田製薬株式会社
東京都新宿区四谷1丁目7番地