

储存方法：室温保
有效期限：5年

日本标准商品分类编号

872473

持续性卵泡激素制剂

雌二醇戊酸酯

处方笺医药品[※]

ペラニンデポー筋注5mg
ペラニンデポー筋注10mg

PELANIN DEPOT Intramuscular Injection 5mg
PELANIN DEPOT Intramuscular Injection 10mg

	5mg	10mg
认证编号	21900AMX01384000	21900AMX01383000
贩卖开始	1956年8月	1954年11月

注) 注意一要根据医师的处方笺使用

2. 禁忌（出现以下情况的患者禁用本品）

- 2.1 雌激素依存性恶性肿瘤（例如、乳腺癌、子宫内膜癌）及疑受性激素影响的患者 [会出现有促使肿瘤恶化或者显性化的情况。] [参照 8.2]
- 2.2 有乳腺癌既往病史的患者 [有可能导致乳腺癌复发。] [参照 8.2]
- 2.3 有未治疗的子宫内膜增生症的患者 [子宫内膜增生症会伴有上皮细胞异型性的情况。] [参照 8.2]
- 2.4 血栓性静脉炎、肺栓塞患者或者有该既往病史的患者 [会增加血栓形成的几率。] [参照 11.1.1]
- 2.5 动脉性血栓疾病（例如、冠心病、脑卒中）或者有既往病史的患者 [参照 11.1.1、15.1.3、15.1.4]
- 2.6 重度肝脏疾病患者 [参照 9.3.1]
- 2.7 未确诊的性器官异常出血的患者 [由子宫内膜癌引起出血的情况、使用本品会加剧癌症的恶化和显性化。] [参照 8.2]
- 2.8 已经怀孕或者可能怀孕的女性 [参照 9.5]

3. 组成·性状

3.1 组成

产品名	ペラニンデポー筋注 5mg	ペラニンデポー筋注 10mg
有效成分	戊酸雌二醇 1管中 5mg	1管中 10mg
添加剂	芝麻油（注射用）	适量

3.2 制剂性状

产品名	ペラニンデポー筋注5mg	ペラニンデポー筋注10mg
性状	无色～微黄色的澄明油液（油性注射剂）	

4. 功效或效果

无月经、月经周期异常（月经稀少、月经频繁）、月经量异常（月经过少、月经过多）、月经困难症、功能性子宫出血、子宫发育不全症、卵巢缺失症状、更年期障碍、不育症

6. 用法及用量

戊酸雌二醇、通常成人1次的用量为5～10mg、每1～4周进行一次肌肉注射。另外，通过症状适当调整药量。

8. 重要的基本注意事项

8.1 根据外国的研究、长期并用卵泡激素剂与黄体激素剂（雌二醇-孕激素）治疗的女性与作为对照组的女性相比、患乳腺癌的风险增高、因为有报告显示其危险性随着并用时间的增长而升高、故使用本剂的患者需要完全了解其承受的风险与收益、同时将药物控制在必要的最小限度内使用、不要贸然地长期使用该药物。 [参照 15.1.2]

8.2 在给药前进行病历、家族遗传等的问诊、乳房检查以及其他妇科检查（通过包括子宫内膜细胞检查和超声波检查的方式测定子宫内膜厚度）、给药后定期进行乳房检查和妇科检查。

[参照 2.1-2.3、2.7、9.1.1、9.1.2、9.1.8]

9. 有关特定背景患者的注意事项

9.1 有并发症·过往史等的患者

9.1.1 子宫肌瘤患者

有可能会促使子宫肌瘤的发育。 [参照 8.2]

9.1.2 患有子宫内膜症的患者

症状有可能会加重。 [参照 8.2]

9.1.3 患心脏病或有心脏病病史的患者

水钠潴留引发的高钙血症可能会使症状加重。

9.1.4 癫痫患者

由体液潴留导致、癫痫恶化的风险。

9.1.5 有精神障碍既往病史的患者

可能会导致精神障碍复发。

9.1.6 糖尿病患者

会加剧糖尿病症状、给药期间应当做好充足的管理。

9.1.7 无法确定骨骼生长发育结束的患者、青春期的患者

有引起骨骼早期闭锁、性早熟的风险。 [参照 9.7]

9.1.8 有乳腺癌家族遗传因素的患者、有乳房结节的患者、乳腺病的患者或乳房X光图像出现异常的患者

症状有可能会加重。 [参照 8.2]

9.1.9 术前或是长期卧床状态的患者

导致凝血功能增强、有可能导致心血管系统危险性变高。 [参照 11.1.1]

9.1.10 患全身性红斑狼疮的患者

症状有可能会加重。

9.2 肾功能障碍的患者

9.2.1 患有肾病或有既往病史的患者

水钠潴留引发的高钙血症可能会使症状加重。

9.3 有肝功能障碍的患者

9.3.1 重度肝功能障碍患者

请勿给药。代谢能力低下导致肝脏的负担增加、症状有可能会加重。 [参照 2.6]

9.3.2 有肝功能障碍的患者（重度肝功能障碍的患者除外）

因为代谢功能低下、本品的作用可能会被增强。

9.5 孕妇

妊娠及可能妊娠的妇女禁止使用本剂。有报告显示将卵泡激素剂用于妊娠的动物（鼠类）、其后代长大后发现阴道上皮和子宫内膜的癌性变性1,2)。另外、有报告称给新生儿（鼠类）使用本剂合、婴儿成长后、发现阴道上皮癌性变性3)。 [参照 2.8]

9.6 哺乳期妇女

通过考虑治疗上的有益性与对母乳营养的影响、决定哺乳的继续或中止。

9.7 儿童用药

[参照 9.1.7]

10. 药物相互作用

10.2 并用注意（并用时需要注意）

药剂名等	临床症状·措施方法	机制·危险因素
降低血糖药 格列本脲（优降糖） 格列齐特 醋酸己脲 等	会减弱降低血糖的作用。应充分观察血糖值与患者的其他状态、注意调节降血糖剂的用量。	卵泡激素（主要是结合型雌激素、合成雌激素）被认为具有改变耐糖能力、使血糖上升的作用。

11. 副作用

出现以下的情况时、需要对患者进行充分地观察、发现异常时采用例如中止给药等适当的处理措施。

11.1 重大副作用

11.1.1 血栓症（频度不明）

被报告有长期连用导致的血栓症。[参照 2.4、2.5、9.1.9]

11.2 其他副作用

	频度不明
过敏症状	皮疹等
精神神经类	精神障碍复发
电解质代谢	高钙血症 ^{注)} 、水钠滞留 ^{注)}
子宫	撤退性出血、子宫异常出血、经血量变化
乳房	乳房痛、乳房不快感
给药部位	疼痛、发红、硬结等
其他	头痛

注) 特别是大剂量使用时会有可能出现。

14. 应用上的注意事项

14.1 给药时的注意事项

14.1.1 本剂只能用于肌肉内注射。

14.1.2 避免影响生理月经的用药。

14.1.3 肌肉内注射时为了避免对组织·神经等产生影响、需要注意以下几点。

· 避开神经走向部位。

刺入注射针时、如果感觉到神经受到的剧痛的情况、应立即拔针、改变部位进行注射。

· 需重复注射的情况下、使用如左右交替注射等方法、改变注射部位。

· 轻轻抽动活塞、确认没有血液流入针筒之后进行注药。

15. 其他注意事项

15.1 基于临床使用的信息

15.1.1 激素替代疗法（HRT）与子宫内膜癌的风险

长时间（约一年以上）使用卵泡激素剂的绝经后女性患子宫内膜癌的风险、比对照组的女性风险高、这一风险与持续使用时间长度有关（1~5年之间2.8倍、十年以上是9.5倍）、流行病学调查报告显示可以通过与黄体激素剂并用以抑制此风险（是对照组女性风险的0.8倍）⁴⁾。

15.1.2 HRT与乳腺癌的风险

(1) 以美国绝经后女性为对象的随机化临床试验

（Women's Health Initiative (WHI) 测试）的结果、有结合型雌激素·黄体激素配合剂会导致乳腺癌的危险性与安慰剂组相比显著提高（比例：1.24）的报告⁵⁾。同时进行的对子宫摘除者的试验结果显示、结合性雌激素单药组与安慰剂组相比患乳腺癌的危险性没有明显区别（比例：0.80）^{6,7)}。[参照 8.1]

(2) 英国的流行病学调查（Million Women Study (MWS)）的结果显示、在同时使用卵泡激素剂和黄体激素的女性中、患乳腺癌的风险与对照群相比有显著的提高（2.00

倍）、这种危险性随着并用期的变长而变高（不满1年：1.45倍、1~4年：1.74倍、5~9年：2.17倍、十年以上：2.31倍）⁸⁾。[参照 8.1]

15.1.3 HRT与冠心病的风险

美国的WHI试验结果显示、结合型雌激素·黄体激素配合剂给药组中、发生冠心病的风险与使用安慰剂组的相比较、特别是在使用开始一年后有显著的提高（比例：1.81）⁹⁾。同时进行的对子宫摘除者的试验结果显示、在结合型雌激素单药组中、冠心病的风险与安慰剂组的相比没有明显的差别（比例：0.91）。[参照 2.5]

15.1.4 HRT与脑卒中的风险

美国的WHI试验结果显示、结合型雌激素·黄体激素配合剂给药组中、脑卒中（主要是脑梗塞）的风险与安慰剂组相比有显著提高（比例：1.31）¹⁰⁾。同时进行的对子宫摘除者的试验结果显示、使用结合型雌激素单药组中与安慰剂组相比、脑卒中（主要是脑梗塞）的风险明显提高（比例：1.37）^{6,11)} [参照 2.5]

15.1.5 HRT与痴呆症的风险

美国65岁以上以绝经后女性为对象的随机化临床试验（WHI Memory Study (WHIMS)）的结果表示、结合型雌激素·黄体激素配合剂给药组中、患包括阿尔茨海默症在内的痴呆症的风险与安慰剂组相比有明显的提高（比例：2.05）¹²⁾。同时进行的对子宫摘除者的试验结果显示、在使用结合型雌激素单药组中、与安慰剂组相比患包括阿尔茨海默症在内的痴呆症的风险虽不显著、但也有很高的倾向（比例：1.49）¹³⁾。

15.1.6 HRT与卵巢癌的风险

(1) 据流行病学调查结果、长期使用卵泡激素制剂的绝经后女性被报告、患卵巢癌的风险比对照组的女性要高¹⁴⁻¹⁶⁾。

(2) 美国的WHI试验结果表明、结合型雌激素·黄体激素配合剂给药组中、患卵巢癌的风险与安慰剂组的相比虽然并不是很明显、但是也有很高的倾向（比例：1.58）¹⁷⁾。

15.1.7 HRT与胆囊疾病的风险

美国的WHI试验结果表明、在结合型雌激素·黄体激素配合剂的用药组中、患胆囊疾病的风险与安慰剂组的相比有显著的提高（比例：1.59）。同时进行的对子宫摘除者的试验结果显示结合型雌激素单药组与安慰剂组相比、患胆囊疾病的危险性显著提高（比例：1.67）。

18. 药效药理

18.1 作用机制

戊酸雌二醇、在体内被代谢成雌二醇。雌二醇作为控制和维持子宫等女性生殖器的机能的激素、能使女性第二性征显现¹⁹⁻²²⁾。

18.2 对子宫的作用

雌二醇会使子宫发生明显的变化、特别是增加子宫内膜基质的水分积累而使之肥大。另外、雌二醇也被认为可以增大钠的摄入率^{21,22)}。戊酸雌二醇对子宫重量增加的作用无论是有效性还是持续性、均比雌二醇及苯甲酸雌二醇更优²³⁾（大鼠）。

18.3 对视丘下部-下垂体的抑制作用

戊酸雌二醇对垂体分泌促性腺激素（FSH）起抑制作用、该作用效果比雌三醇更强更持久。

19. 有效成分の理化学知識

一般名：戊酸雌二醇 (Estradiol Valerate)

化学名(中)：1,3,5(10)-雌三烯-3,17β-雌二醇,17β-戊酸酯

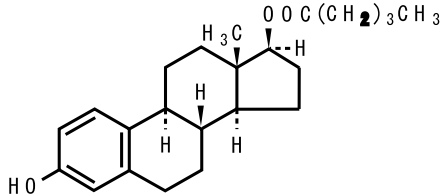
化学名(英)：Estra-1,3,5(10)-triene-3,17β-diol 17-pentanoate

分子式：C₂₅H₃₂O₃

分子量：356.50

性状：白色的结晶或白色的结晶粉末、无味。易溶于乙醇(95)、1,4-二恶烷或二乙醚、稍微易溶于甲醇、不易溶于芝麻油、几乎不溶于水。

化学构造式：



融点：143~150℃

22. 包装

〈ペラニンデポー筋注5mg〉

安瓿瓶：1mL×10管

〈ペラニンデポー筋注10mg〉

安瓿瓶：1mL×10管

23. 主要文献

- 1) 安田佳子 他：医学のあゆみ. 1976; 98 (8) : 537-538
- 2) 安田佳子 他：医学のあゆみ. 1976; 99 (8) : 611-612
- 3) 守隆夫：医学のあゆみ. 1975; 95 (11) : 599-602
- 4) Grady, D. et al.: Obstet. Gynecol. 1995; 85 (2) : 304-313
- 5) Chlebowski, R. T. et al.: JAMA. 2003; 289 (24) : 3243-3253
- 6) Anderson, G. L. et al.: JAMA. 2004; 291 (14) : 1701-1712
- 7) Stefanick, M. L. et al.: JAMA. 2006; 295 (14) : 1647-1657
- 8) Beral, V. et al.: Lancet. 2003; 362 (9382) : 419-427
- 9) Manson, J. E. et al.: N. Engl. J. Med. 2003; 349 (6) : 523-534
- 10) Wassertheil-Smoller, S. et al.: JAMA. 2003; 289 (20) : 2673-2684
- 11) Hendrix, S. L. et al.: Circulation. 2006; 113 (20) : 2425-2434
- 12) Shumaker, S. A. et al.: JAMA. 2003; 289 (20) : 2651-2662
- 13) Shumaker, S. A. et al.: JAMA. 2004; 291 (24) : 2947-2958
- 14) Rodriguez, C. et al.: JAMA. 2001; 285 (11) : 1460-1465
- 15) Lacey, J. V. Jr. et al.: JAMA. 2002; 288 (3) : 334-341
- 16) Beral, V. et al.: Lancet. 2007; 369 (9574) : 1703-1710
- 17) Anderson, G. L. et al.: JAMA. 2003; 290 (13) : 1739-1748
- 18) Cirillo, D. J. et al.: JAMA. 2005; 293 (3) : 330-339
- 19) 鈴木雅洲 他監修：産婦人科シリーズ No.2 ホルモン療法のすべて. 南江堂; 1972. 49-60
- 20) 西川光夫 他編：臨床内分泌学. 医学書院; 1969. 404
- 21) 小林 隆 他監修：現代産科婦人科学大系 第4巻B 基礎内分泌学 II. 中山書店; 1971. 308-315
- 22) 梅原千治 他：ステロイドホルモン III 卵胞ホルモン. 南江堂; 1966. 55-77
- 23) Miescher, K. et al.: Biochem. J. 1938; 32 (8) : 1273-1280

24. 文献索取方及咨询处

持田製薬株式会社 くすり相談窓口

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

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売源



持田製薬株式会社
東京都新宿区四谷1丁目7番地



ひな译, 希望自己能帮助到更多人(?)

给自己肌注一直都是比较危险的事情, 所以ひな希望大家能至少有一份自己能看懂的说明书可以参考 (((((