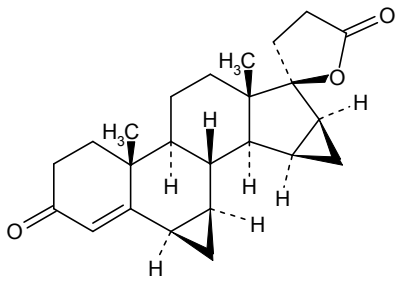
2.6.1　緒言

BAY 86-5300（以下、本剤）は、合成黄体ホルモンであるドロスピレノン（DRSP）3mg と合成卵胞ホルモンであるエチニルエストラジオール（EE）0.020mg を含有する経口医療用配合剤である。EE はβ-シクロデキストリン包接化合物のエチニルエストラジオール　ベータデクスとして配合されている。すなわち、本剤は、2010 年 7 月に月経困難症を効能・効果として承認されたヤーズ®配合錠（実薬錠 24 錠とプラセボ錠 4 錠からなる 28 錠の製剤）の実薬錠と同一製剤である。

DRSP 及び EE betadex の化学構造式を図 2.6.1- 1 に示す。

DRSP



一般名：Drospirenone、ドロスピレノン

分子式：$C_{24}H_{30}O_3$

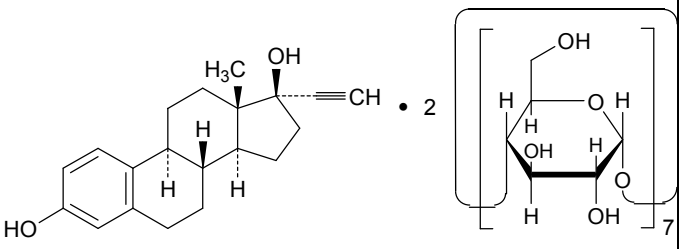
分子量：366.49

化学名

日本名：3-オキソ-6β,7β:15β,16β-ジメタノ-17α-プレグナ-4-エン-21,17-カルボラクトン

英名：3-Oxo-6β,7β:15β,16β-dimethano-17α-pregn-4-ene-21,17-carbolactone

EE betadex



一般名：Ethinylestradiol Betadex、 エチニルエストラジオール　ベータデクス

分子式：$C_{20}H_{24}O_2 \cdot 2C_{42}H_{70}O_{35}$

分子量：2,566.37

化学名

日本名：19-ノル-17α-プレグナ-1,3,5(10)-トリエン-20-イン-3,17-ジオール―ジ-β-シクロデキストリン

英名：19-Nor-17α-pregna-1,3,5(10)-triene-20-yne-3,17-diol―di-β-cyclodextrin

図 2.6.1- 1　DRSP と EE betadex の化学構造式

今般、本剤の月経困難症及び子宮内膜症に対するフレキシブル処方での開発が進められ、下記の効能・効果及び用法・用量で承認申請〔申請区分は医療用医薬品：新効能医薬品、新用量医薬品、剤形追加に係る医薬品（再審査期間中のもの）〕を行うこととした。なお、本剤の効能に関連する効力を裏付ける試験（排卵抑制作用及び子宮内膜増殖抑制作用）、及び非臨床薬物動態試験に関する資料は、ヤーズ配合錠の承認時に提出しており、本剤の薬理学的及び薬物動態学的プロファイルは既に明らかにされている（ヤーズ配合錠の承認申請資料 2.6.2、2.6.4 を参照）。したがって、新たな提出資料はない。

■効能・効果

子宮内膜症に伴う疼痛の改善、月経困難症

■用法・用量

1 日 1 錠を連続経口投与する。24 日目までは出血の有無にかかわらず連続投与する。25 日目以降に原則 3 日間連続で出血（点状出血を含む）が認められた場合、又は、連続投与が 120 日に達した場合は、4 日間休薬する。

以後同様に連続投与と休薬を繰り返す。