目次

頁
2.2　緒言 2
2.2.1　要約 2
2.2.2　適応症 2
2.2.3　本剤の化学構造 2
2.2.3.1　デソゲストレル 2
2.2.3.2　エチニルエストラジオール 2
2.2.4　薬理学的分類及び作用機序 3

2.2　緒言

2.2.1　要約

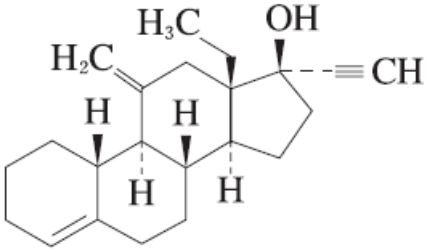
Organon and Co の子会社である Organon LLC（以下、「申請者」）は、月経困難症の治療を目的として OG-8276A を開発している。当初、OG-8276A は申請者によって避妊への使用を目的に開発され、1986年2月11日に英国で最初に承認され、その後52カ国で用いられている。

2.2.2　適応症

デソゲストレル（DSG）150 µg 及びエチニルエストラジオール(EE) 20 µg（DSG/EE 150/20）を含有する OG-8276A（Mercilon、以下、「本剤」）は、月経困難症の治療を目的とする低用量エストロゲン・プロゲスチン配合製剤である。

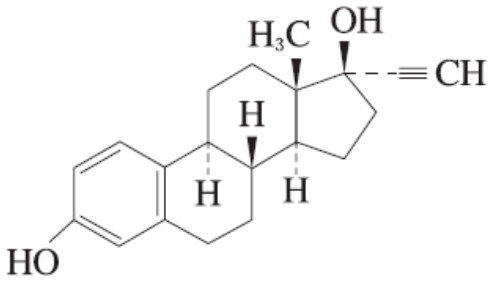
2.2.3　本剤の化学構造

2.2.3.1　デソゲストレル



一般名称：デソゲストレル（Desogestrel）
分子式：$C_{22}H_{30}O$
分子量：310.47
化学名：（+）-17α-Ethynyl-18-methyl-11-methylene-4-estren-17-ol

2.2.3.2　エチニルエストラジオール



一般名称：エチニルエストラジオール（Ethinylestradiol）
分子式：$C_{20}H_{24}O_2$
分子量：296.40
化学名：19-Nor-17α-pregna-1,3,5（10）-triene-20-yne-3,17-diol

2.2.4　　薬理学的分類及び作用機序

本剤は低用量のエストロゲン・プロゲスチンを配合する錠剤であり、排卵を抑制しプロスタグランジン産生を減少させる作用を有する。経口投与後、デソゲストレルは速やかに活性代謝物であるエトノゲストレル（ENG）に変換される。活性代謝物 ENG は主に下垂体からのゴナドトロピン放出を減少させる。その結果、卵胞の発育が抑制され、排卵に必要な黄体形成ホルモン（LH）の中期急増を刺激するエストラジオールの産生が減少する。さらに、プロゲスチンはエストロゲンによる子宮内膜増殖を抑制するため、プロスタグランジン産生に寄与する組織量も減少する。エチニルエストラジオールは卵巣抑制による低エストロゲン状態を防ぎ、子宮内膜を安定化させることにより不規則な出血を抑制する。