ASKA

2020年11月改訂（第1版）

日本標準商品分類番号
872529

承認番号	21900AMX01648
販売開始	1962年6月

卵胞ホルモン製剤
エストリオール製剤

処方箋医薬品注)

ホーリン®V腟用錠1mg

HOLIN®-V VAGINAL TABLETS

貯　　法：室温保存
有効期間：5年

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 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。］［8. 参照］
2.2 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2.3 妊婦又は妊娠している可能性のある女性［9.5参照］

3. 組成・性状

3.1 組成

販　売　名	ホーリンV腟用錠1mg
有 効 成 分	1錠中 日局エストリオール1mg
添　加　剤	マクロゴール6000、ステアリン酸マグネシウム

3.2 製剤の性状

販　売　名	ホーリンV腟用錠1mg		
剤　　形	白色の腟用素錠（割線入り）		
外　　形	表	側面	裏
	長径12.0mm　短径7.0mm　厚さ4.7mm　質量300mg		
識別コード	TZ186（PTP包装に表示）		

4. 効能又は効果

腟炎（老人、小児及び非特異性）、子宮頸管炎並びに子宮腟部びらん

6. 用法及び用量

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

8. 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。［2.1、9.1.1-9.1.5参照］

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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。［8. 参照］

9.1.2 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。［8. 参照］

9.1.3 子宮内膜症のある患者
症状が増悪するおそれがある。［8. 参照］

9.1.4 乳癌の既往歴のある患者
乳癌が再発するおそれがある。［8. 参照］

9.1.5 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。［8. 参照］

9.1.6 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
骨端の早期閉鎖、性的早熟を来すおそれがある。［9.7参照］

9.5 妊婦

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。卵胞ホルモン剤を妊娠動物（マウス）に投与した場合、児の成長後腟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[1),2)]。また、新生児（マウス）に投与した場合、児の成長後腟上皮の癌性変性を認めたとの報告がある[3)]。［2.3参照］

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

9.7 小児等

［9.1.6参照］

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック（頻度不明）、**アナフィラキシー**（頻度不明）
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。

11.1.2 血栓症（頻度不明）
長期連用により、血栓症が起こることが報告されている。

11.2 その他の副作用

	頻度不明
過敏症	発疹等
乳房	乳房痛、乳房緊満感等

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

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。

14.2 薬剤交付時の注意

本剤は腟内挿入のみに使用し、内服させないこと。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

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女性では、子宮内膜癌になる危険性が対照群の女性と比較して高く、この危険性は、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[4)-6)]。

16. 薬物動態

16.4 代謝

肝において3位水酸基のグルクロン酸抱合などを受けた後、胆汁排泄などにより消失する[7)]。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

腟炎、子宮腟部びらん、子宮頸管炎に対し、主として1回1錠、3～10回の投与により、局所症状の改善をみとめ、腟脂膏は角化傾向を示した[8)-10)]。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

エストラジオールが肝臓で代謝されて出来る物質で、エストロゲンとしての作用を現す[7)]。

18.2 子宮及び腟に対する作用

18.2.1 子宮頸部・腟部を軟化させるが、子宮肥大作用は弱い（ラット[11)]、モルモット[12)-14)]、家兎[12)]、ヒト[15)-18)]）。

18.2.2 腟粘膜上皮の肥厚・増殖、血管形成を促す（マウス[19)]、ラット[11)]、ヒト[15),20)-22)]）。

18.2.3 子宮頸部のアミノ態窒素及びリンの取込みを増加させる（モルモット[14]）。

18.2.4 腟粘膜細胞の角化現象を指標とした場合、腟内投与は皮下投与に比し、より少量で作用を示す（マウス[23]）。

18.2.5 去勢患者において腟脂肪角化係数の上昇をみた[8]。

18.3 ゴナドトロピン分泌抑制作用

脳下垂体性ゴナドトロピンの分泌を抑制する（ラット[24),25]、ヒト[26]）。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：エストリオール（Estriol）

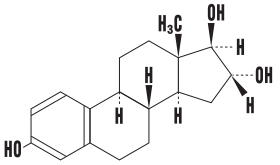
化学名：Estra-1,3,5(10)-triene-3,16α,17β-triol

分子式：$C_{18}H_{24}O_3$

分子量：288.38

性状：白色の結晶性の粉末で、においはない。
メタノールにやや溶けにくく、エタノール（99.5）に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

化学構造式：



融点：281～286℃

22. 包装

100錠［10錠(PTP)×10］

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) Ziel,H.K.et al.:New Engl.J.Med.1975;293(23):1167-1170
5) Smith,D.C.et al.:New Engl.J.Med.1975;293(23):1164-1167
6) Mack,T.M.et al.:New Engl.J.Med.1976;294(23):1262-1267
7) 第十七改正日本薬局方解説書.廣川書店;2016.C804-807
8) 平林正楠他:ホルモンと臨床.1962;10(6):396-400
9) 塩見勉三他:産婦人科の世界.1963;15(5):665-670
10) 鈴木三郎他:産婦人科の世界.1963;15(10):1257-1259
11) Overbeek,G.A.et al.:Acta Endocrinol.1958;27(1):73-76
12) Puck,A.et al.:Acta Endocrinol.1956;22(3):191-202
13) Puck,A.et al.:Geburtsh.Frauenh.1960;20:132-141
14) 安藤晴弘他:産婦人科の世界.1962;14(12):1557-1560
15) Puck,A.et al.:Dtsch.Med.Wschr.1957;82(44):1864-1866
16) Puck,A.:Geburtsh.Frauenh.1958;18(8):998-1003
17) Puck,A.:Geburtsh.Frauenh.1960;20:775-779
18) 長崎康夫:日本産科婦人科学会雑誌.1961;13(8):943-951
19) Nicol,T.et al.:J.Endocrinol.1966;34(3):377-386
20) Borglin,N.E.:Acta Obstet.Gynec.Scand.1959;38(2):157-171
21) Kusuda,M.et al.:Kyushu J.Med.Sci.1963;14:1-5
22) Dapunt,O.et al.:Geburtsh.Frauenh.1968;28(12):1142-1157
23) Emmens,C.W.:J.Endocrinol.1940;2(2):444-458
24) 高木繁夫他:ホルモンと臨床.1961;9(2):145-149
25) 相沢義雄:臨床薬理学大系 第12巻 ホルモン.中山書店;1966.p.65-67
26) 赤須文男他:産婦人科の世界.1960;12(3):313-318

24. 文献請求先及び問い合わせ先

あすか製薬株式会社　くすり相談室
〒108-8532　東京都港区芝浦二丁目5番1号
TEL 0120-848-339
FAX 03-5484-8358

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

あすか製薬株式会社
東京都港区芝浦二丁目5番1号

26.2 販売元

武田薬品工業株式会社
大阪市中央区道修町四丁目1番1号