

貯法：室温保存

有効期間：36ヵ月

処方箋医薬品(注意—医師等の処方箋により使用すること)

承認番号 30400AMX00268

販売開始 1975年10月

## LH分泌ホルモン剤

### ゴナドレリン酢酸塩製剤

# LH-RH注0.1mg「ニプロ」

## LH-RH Injection

### 3. 組成・性状

#### 3.1 組成

有効成分	1管中(1mL) 日局 ゴナドレリン酢酸塩 0.1mg
添加剤	1管中(1mL) 氷酢酸 0.06mg 酢酸ナトリウム水和物 0.04mg D-ソルビトール 50.0mg

#### 3.2 製剤の性状

製剤の外観	無色透明の液
pH	4.0~5.0
浸透圧比 (生理食塩液に対する比)	約1

### 4. 効能又は効果

#### ○下垂体LH分泌機能検査

正常反応は個々の施設によって設定されるべきであるが、通常、正常人では投与後30分で血中LH値がピークに達し、ラジオイムノアッセイによる血中のそれは30mIU/mL以上になる。しかし、投与後30分の血中LH値だけで十分な判定ができないと考えられる場合は、投与後経時的に測定し、判定することが望ましい。

なお、判定に当たっては、以下の点を考慮することが望ましい。

- 皮下・筋肉内注射時の血中LH反応は、静脈内注射時のそれより低いと考えられる。
- 排卵期の女性は投与前血中レベル及び投与後の血中LH反応が高く、小児では低い。

### 6. 用法及び用量

通常成人には、1回本剤1管を静脈内、皮下又は筋肉内に注射する。

静脈内注射の場合は、生理食塩液、ブドウ糖注射液あるいは、注射用水5~10mLに混じて、徐々に注射する。

### 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 遺伝性果糖不耐症の患者

本剤の添加剤D-ソルビトールが体内で代謝されて生成した果糖が正常に代謝されず、低血糖、肝不全、腎不全等が誘発されるおそれがある。

##### 9.1.2 下垂体腺腫患者

[11.1.1 参照]

#### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性は投与しないことが望ましい。動物実験で流産(マウス：0.04mg/kg)若しくは分娩遅延(マウス：0.02mg/kg、ラット：0.04mg/kg)が認められている。

### 9.6 授乳婦

診断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。

### 9.8 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 下垂体卒中(0.1%未満)

下垂体腺腫患者に投与した場合、まれに頭痛、視力・視野障害等を伴う下垂体卒中があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には外科的治療等適切な処置を行うこと。[9.1.2 参照]

##### 11.1.2 ショック(頻度不明)

#### 11.2 その他の副作用

	0.1%未満
子宮	月経早期発来

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤投与時の注意

##### 14.1.1 注射部位

皮下、筋肉内投与により、注射部位に疼痛を訴えることがある。

##### 14.1.2 投与時

皮下又は筋肉内に投与する場合には、神経及び血管を避けて慎重に投与すること。

なお、幼小児においては、特に注意すること。

### 16. 薬物動態

#### 16.1 血中濃度

健康成人4例(男2、女2)及び間脳下垂体疾患患者6例(男3、女3)にLH-RHを100 $\mu$ g静脈内投与した場合、血中第一半減期は5.3分、第二半減期は27.4分で健康群と患者群に差は認められない。<sup>1)</sup>

#### 16.5 排泄

健康成人4例(男2、女2)及び間脳下垂体疾患患者6例(男3、女3)にLH-RHを100 $\mu$ g静脈内投与した場合、静注後24時間までに投与量の1.6%(10例平均)が尿中へ排泄される。<sup>1)</sup>

### 17. 臨床成績

#### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

##### 17.1.1 国内臨床試験

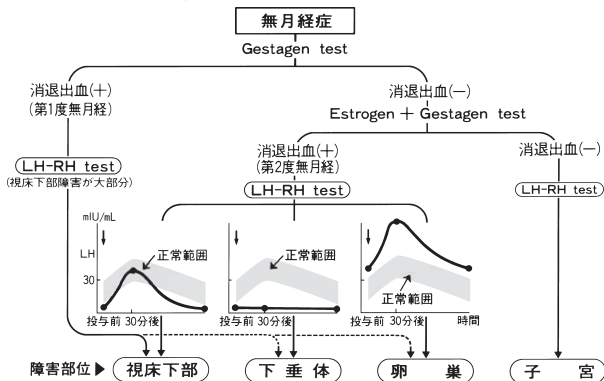
LH-RH(100 $\mu$ g)負荷による血中LH反応パターンよりの障害部位鑑別は下表のとおりである。

24機関830例の臨床試験成績

		LH-RH 投与前		LH-RH投与後 (30分)	
		LH値 (mIU/mL)	反応の有無	LH値 (mIU/mL)	
正常人	成人(男女)、小児	30未満	+	30以上	
	高齢者(50歳以上)	40以上	+	40以上(高値)	
	排卵期女子	60以上	+	200以上	
性腺機能低下症	視床下部性	30未満(低値)	±~+	30以上	
	下垂体性	30未満(低値)	-	30未満(低値)	
	原発性	30以上	+	30以上(高値)	

(参考)

症候論的試験とLH-RHテストにより下図の如く障害部位鑑別を行う



## 18. 薬効薬理

### 18.1 測定法

下垂体前葉を刺激してLH(luteinizing hormone)及びFSH(follicle stimulating hormone)の分泌を促進する。<sup>2-9)</sup>

### 18.2 LH分泌促進作用

健康成人男子に100 $\mu$ g静脈内投与したとき、血中LH値は10分後より上昇し、30分後に最大(80.3 $\pm$ 18.5mIU/mL)に達し、以後漸減する。<sup>8)</sup>

### 18.3 FSH分泌促進作用

健康成人男子に100 $\mu$ g静脈内投与したとき、血中FSH値は10分後より上昇し、30分後に最大(19.0 $\pm$ 11.6mIU/mL)に達し、以後漸減する。<sup>8)</sup>

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ゴナドレリン酢酸塩

(Gonadorelin Acetate)

化学名：5-Oxo-L-prolyl-L-histidyl-L-tryptophyl-L-seryl-L-tyrosyl-glycyl-L-leucyl-L-arginyl-L-prolyl-glycinamide diacetate

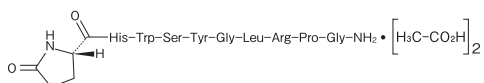
分子式：C<sub>55</sub>H<sub>75</sub>N<sub>17</sub>O<sub>13</sub> · 2C<sub>2</sub>H<sub>4</sub>O<sub>2</sub>

分子量：1302.39

性状：

- ・白色～微黄色の粉末で、においはないか、又はわずかに酢酸臭がある。
- ・水、メタノール又は酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくい。
- ・吸湿性である。
- ・0.10gに水10mLを加えて溶かした液のpHは4.8～5.8である。

構造式：



## 22. 包装

5管[1mL(アンプル)×5]

## 23. 主要文献

- 1) Jeffcoate, S. L. et al. : J. Endocrinol. 1974 ; 60 : 305-314
- 2) 入江 実 : ホルモンと臨床 1976 ; 24 : 708-708
- 3) 鎮目和夫 他 : ホルモンと臨床 1976 ; 24 : 743-750
- 4) 林 基之 他 : 第18回日本不妊学会発表 1973(社内資料)
- 5) 磯島晋三 他 : 日本不妊学会雑誌 1974 ; 19(3) : 237-242
- 6) 堀野正治 他 : 日本内分泌学会雑誌 1974 ; 50(7) : 1077-1090
- 7) 余語郁夫 他 : 産婦人科の進歩 1973 ; 26(3) : 291-297
- 8) 中野 裕 他 : 内科宝函 1973 ; 20(2) : 45-54
- 9) 松垣 鴻 他 : 田辺製薬研究報告 1978 ; 118-121

## \*24. 文献請求先及び問い合わせ先

ニプロ株式会社 医薬品情報室  
〒566-8510 大阪府摂津市千里丘新町3番26号  
TEL : 0120-226-898  
FAX : 050-3535-8939

## \*26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元



ニプロESファーマ株式会社  
大阪府摂津市千里丘新町3番26号