2025年11月改訂（第8版）

日本標準商品分類番号：872499

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018（2019更新版）に準拠して作成

子宮内膜症治療剤・子宮腺筋症に伴う疼痛改善治療剤
ジエノゲスト錠

ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」

Dienogest Tablets 1mg "KISSEI"

ジエノゲスト口腔内崩壊錠

ジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」

Dienogest OD Tablets 1mg "KISSEI"

販売名	ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」 ジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」
剤形	ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」：フィルムコーティング錠 ジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」：口腔内崩壊錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品[注)] 注）注意－医師等の処方箋により使用すること。
規格・含量	ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」：1錠中ジエノゲスト1mg含有 ジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」：1錠中ジエノゲスト1mg含有
一般名	和名：ジエノゲスト（JAN） 洋名：Dienogest（JAN）、dienogest（INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	

	ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」	ジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」
製造販売承認年月日	2017年2月15日	2017年8月15日
薬価基準収載年月日	2017年6月16日	2017年12月8日
販売開始年月日	2017年6月16日	2017年12月8日

製造販売（輸入）・提携・販売会社名	販　売　元：キッセイ薬品工業株式会社 製造販売元：ジェイドルフ製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キッセイ薬品工業株式会社　くすり相談センター フリーダイヤル：0120-007-622 受付時間：土日祝日、当社休日を除く月～金　9:00～17:40 医療関係者向けホームページ　https://med.kissei.co.jp/

本IFは2025年11月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。
右のGS1バーコードより「添文ナビ」アプリからもアクセスいただけます。

ジエノゲスト錠
(01)14987051275126

ジエノゲストOD錠
(01)14987051276123

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 －日本病院薬剤師会－

１．医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、ＭＲ）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、ＩＦと略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第２小委員会がＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第３小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会がＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領 2008 以降、ＩＦはＰＤＦ等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦは、医薬品医療機器総合機構（以下、ＰＭＤＡ）の医療用医薬品情報検索のページ（http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品のＩＦの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のＩＦが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、ＩＦ記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

２．ＩＦとは

ＩＦは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はＩＦの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたＩＦは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

ＩＦの提供は、電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

３．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは、ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってＩＦを作成・提供するが、ＩＦの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やＩＦ作成時に記載し難い情報等については製薬企業のＭＲ等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、ＩＦの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、ＩＦが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、ＩＦの使用にあたっては、最新の添付文書をＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

４．利用に際しての留意点

ＩＦを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。ＩＦは日

病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、ＭＲ等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがＩＦの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、ＩＦを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

（2020 年 4 月改訂）

目　次

Ⅰ.概要に関する項目 1
1. 開発の経緯 1
2. 製品の治療学的特性 1
3. 製品の製剤学的特性 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 1
6. RMP の概要 2

Ⅱ.名称に関する項目 3
1. 販売名 3
2. 一般名 3
3. 構造式又は示性式 3
4. 分子式及び分子量 3
5. 化学名(命名法)又は本質 3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 3

Ⅲ.有効成分に関する項目 4
1. 物理化学的性質 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 4
3. 有効成分の確認試験法、定量法 4

Ⅳ.製剤に関する項目 5
1. 剤形 5
2. 製剤の組成 5
3. 添付溶解液の組成及び容量 6
4. 力価 6
5. 混入する可能性のある夾雑物 6
6. 製剤の各種条件下における安定性 6
7. 調製法及び溶解後の安定性 7
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化) 7
9. 溶出性 7
10. 容器・包装 10
11. 別途提供される資材類 10
12. その他 10

Ⅴ.治療に関する項目 11
1. 効能又は効果 11
2. 効能又は効果に関連する注意 11
3. 用法及び用量 11
4. 用法及び用量に関連する注意 11
5. 臨床成績 11

Ⅵ.薬効薬理に関する項目 13
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 13
2. 薬理作用 13

Ⅶ.薬物動態に関する項目 15
1. 血中濃度の推移 15
2. 薬物速度論的パラメータ 18
3. 母集団(ポピュレーション)解析 18
4. 吸収 18
5. 分布 19
6. 代謝 19
7. 排泄 19
8. トランスポーターに関する情報 20
9. 透析等による除去率 20
10. 特定の背景を有する患者 20
11. その他 20

Ⅷ.安全性(使用上の注意等)に関する項目 21
1. 警告内容とその理由 21
2. 禁忌内容とその理由 21
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 21
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 21
5. 重要な基本的注意とその理由 21
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 22
7. 相互作用 22
8. 副作用 24
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 25
10. 過量投与 25
11. 適用上の注意 25
12. その他の注意 25

Ⅸ.非臨床試験に関する項目 26
1. 薬理試験 26
2. 毒性試験 26

Ⅹ.管理的事項に関する項目 27
1. 規制区分 27
2. 有効期間 27
3. 包装状態での貯法 27
4. 取扱い上の注意 27
5. 患者向け資材 27
6. 同一成分・同効薬 27
7. 国際誕生年月日 27
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 28
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 28
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 28
11. 再審査期間 28
12. 投薬期間制限に関する情報 28
13. 各種コード 28
14. 保険給付上の注意 28

Ⅺ.文献 29
1. 引用文献 29
2. その他の参考文献 30

Ⅻ.参考資料 31
1. 主な外国での発売状況 31
2. 海外における臨床支援情報 31

XIII.備考 32
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 32
2. その他の関連資料 32

Ⅰ．概要に関する項目

1. 開発の経緯

ジエノゲスト錠は子宮内膜症治療剤・子宮腺筋症に伴う疼痛改善治療剤であり、本邦では2008年に子宮内膜症治療剤、2015年に子宮腺筋症に伴う疼痛改善治療剤として上市されている。ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」及びジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」は、ジェイドルフ製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、それぞれ2017年2月及び2017年8月に「子宮内膜症」に対する効能・効果で製造販売承認を取得した。また、2021年3月に「子宮腺筋症に伴う疼痛の改善」の効能・効果を取得した。

2. 製品の治療学的特性

有効性：ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」及びジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」は、子宮内膜症及び子宮腺筋症に伴う疼痛の改善に対して、通常、成人にはジエノゲストとして1日2mgを2回に分け、月経周期2～5日目より経口投与することにより、有効性が認められている。(「Ⅴ．1．効能又は効果」及び「Ⅴ．3．用法及び用量」の項参照)

安全性：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。
重大な副作用：重篤な不正子宮出血、重度の貧血、アナフィラキシー（「Ⅷ．8．(1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）
副作用：ほてり、頭痛、不正子宮出血、外陰部かぶれ・かゆみ、悪心等（「Ⅷ．8．(2) その他の副作用」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

・錠剤とOD錠の2つの剤形を有する。OD錠は口腔内で速やかに崩壊する口腔内崩壊錠である。
・白色、円形のフィルムコーティング錠である（ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」）。
・淡黄色、円形の口腔内崩壊錠である（ジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」）。
・PTPシート裏面に「適正使用に関する情報へのリンク（二次元コード）」を表示した。

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」
ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」

(2) 洋名

Dienogest Tablets 1mg “KISSEI”
Dienogest OD Tablets 1mg “KISSEI”

(3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格（含量）＋「キッセイ」
〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号）に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ジエノゲスト（JAN）

(2) 洋名（命名法）

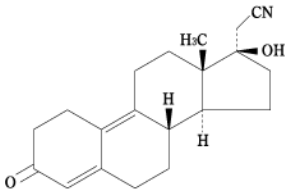
Dienogest（JAN）
dienogest（INN）

(3) ステム

黄体ホルモン（プロゲスチン）類：-gest

3. 構造式又は示性式

構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{20}H_{25}NO_2$
分子量：311.42

5. 化学名（命名法）又は本質

17-Hydroxy-3-oxo-19-nor-17α-pregna-4,9-diene-21-nitrile（IUPAC）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～微黄白色の粉末である。

(2) 溶解性

溶媒	1g を溶かすのに要する溶媒量	溶解性
メタノール	30mL 以上　100mL 未満	やや溶けにくい
アセトニトリル	100mL 以上　1000mL 未満	溶けにくい
エタノール（99.5）	100mL 以上　1000mL 未満	溶けにくい
水	10000mL 以上	ほとんど溶けない

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

比旋光度：-338°～-58°（脱水物に換算したもの 0.125g、メタノール、25mL、100mm）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

定量法

液体クロマトグラフィー

Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

販売名	ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」	ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」
剤形	フィルムコーティング錠	口腔内崩壊錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名		ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」			ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」		
色		白色			淡黄色		
本体表示	表	ジエノゲスト 1 キッセイ			ジエノゲスト OD 1 キッセイ		
	裏						
外形		表	裏	側面	表	裏	側面
直径(mm)		6.6			6.5		
厚さ(mm)		2.9			3.1		
質量(mg)		110			112		
風味					ペパーミント		

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

販売名	ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」	ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」
硬度	103N（10.5kg 重）	63N（6.4kg 重）
摩損度		0.11%

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」	ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」
有効成分	1 錠中ジエノゲスト 1mg	1 錠中ジエノゲスト 1mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、デンプングリコール酸 Na、ステアリン酸 Mg、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 6000、タルク	D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、タルク、黄色三二酸化鉄、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸 Mg、香料、その他 3 成分

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」[1)]

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット（n=3）

試験項目	開始時	6 箇月
性状	白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	95.6～100.3	89.7～98.9
含量(%)	98.5～100.0	99.9～100.8

ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」[2)]

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品（乾燥剤入り）

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット（n=3）

試験項目	開始時	6 箇月
性状	淡黄色の口腔内崩壊錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
崩壊時間(秒)	15～25	18～25
溶出率(%)	93.8～106.3	91.0～106.8
含量(%)	99.3～101.4	99.8～101.8

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度 75%、6 箇月)の結果、ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」及びジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

(2) 無包装状態における安定性

ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」[1)]

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
外観	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
含量	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
溶出性	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

注)「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成 11 年 8 月 20 日」に準じて試験を実施した。

ジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」[2)]

試験項目	開始時	温度 (40℃、3箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3箇月)	光 (120万lx・hr)
外観	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
含量	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
溶出性	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

注)「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成11年8月20日」に準じて試験を実施した。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

9. 溶出性

(1) 規格及び試験方法

ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」及びジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」は、設定された溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている。

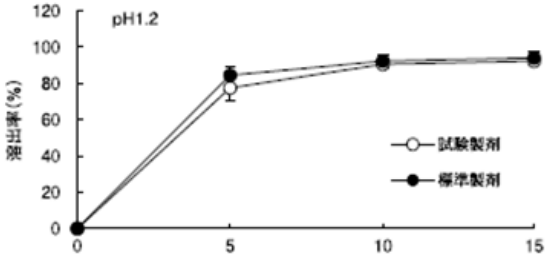
方　法：日局溶出試験法（パドル法）
試験液：水　900mL
回転数：50rpm
測定法：液体クロマトグラフィー
規　格：15分間の溶出率が85%以上のときは適合とする。

(2) 生物学的同等性試験

〈ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」〉[3)]

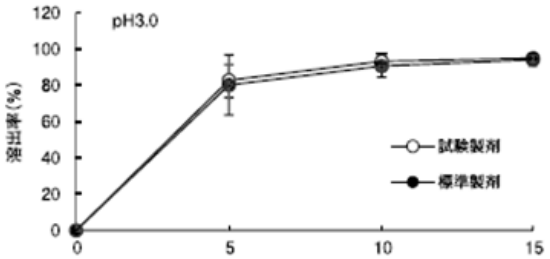
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)(以下、ガイドライン)に従い溶出試験を行った。

〈測定条件〉
試 験 液：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水
回 転 数：50rpm
試験製剤：ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」
検 体 数：n=12（各試験液〉
試 験 法：パドル法
標準製剤：錠剤、1mg



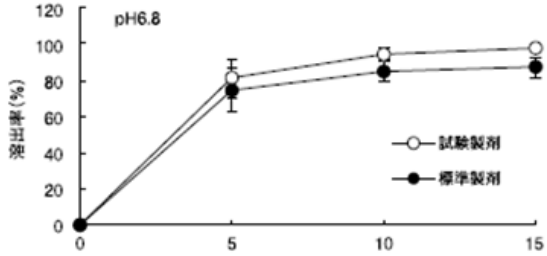
各時間(分)における溶出率(%)

時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	77.8	90.9	92.7
標準偏差	0	7.2	3.2	1.2
標準製剤	0	84.3	92.5	94.0
標準偏差	0	4.2	3.7	3.4



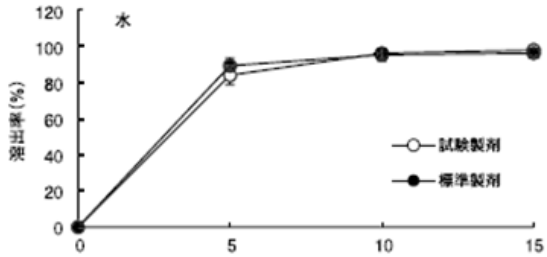
各時間(分)における溶出率(%)

時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	82.4	93.2	95.0
標準偏差	0	8.7	4.2	2.7
標準製剤	0	80.5	90.7	94.4
標準偏差	0	16.6	6.2	3.4



各時間(分)における溶出率(%)

時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	81.1	94.7	97.8
標準偏差	0	11.0	3.2	1.6
標準製剤	0	74.6	85.0	87.3
標準偏差	0	12.1	5.5	5.5



各時間(分)における溶出率(%)

時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	83.9	96.0	97.4
標準偏差	0	4.9	2.2	1.7
標準製剤	0	89.4	94.9	96.0
標準偏差	0	4.0	2.9	2.9

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較（パドル法）

試験条件			平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)	試験製剤	標準製剤			
50	pH1.2	15	92.7	94.0	-1.3	15分以内に平均85%以上溶出	適
	pH3.0	15	95.0	94.4	0.6		適
	pH6.8	15	97.8	87.3	10.5		適
	水	15	97.4	96.0	1.4		適

(n=12)

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。
従って、ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

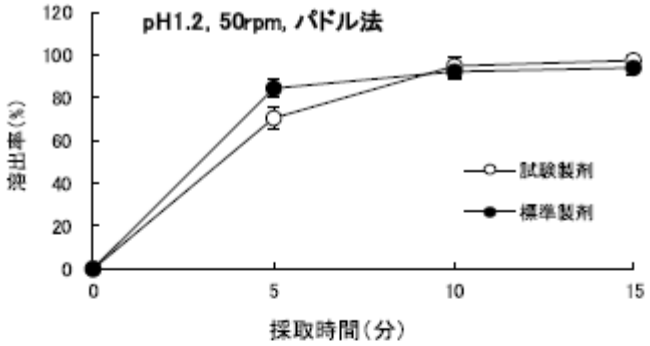
〈ジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」〉[4)]

「剤形が異なる製剤の追加のための生物学的同等性試験ガイドライン」及び「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(いずれも、平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)(以下、ガイドライン)に従い、溶出試験を行った。

（注）標準製剤は普通錠である。

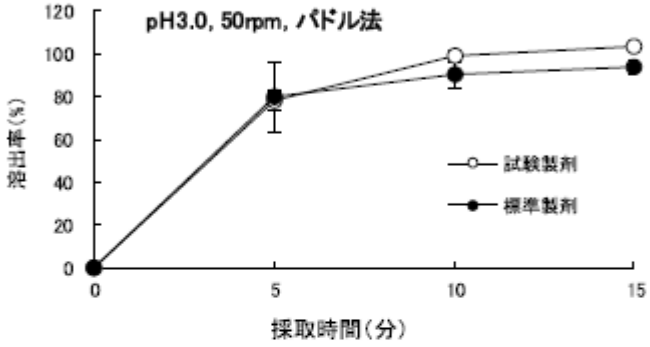
〈測定条件〉

試験液：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水
回転数：50rpm
試験製剤：ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」
検体数：n=12（各試験液）
試験法：パドル法
標準製剤：錠剤、1mg



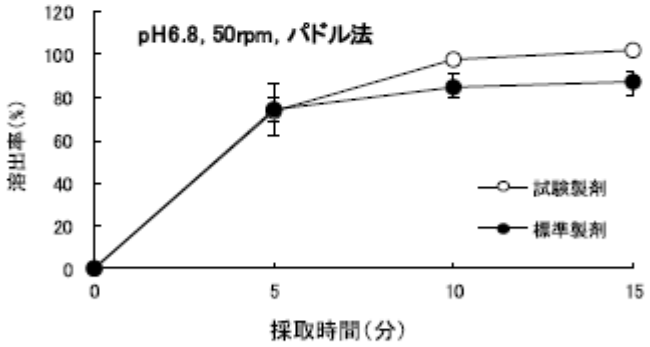
各時間(分)における溶出率(%)

時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	70.4	94.6	98.0
標準偏差	0	5.2	4.5	2.0
標準製剤	0	84.3	92.5	94.0
標準偏差	0	4.2	3.7	3.4



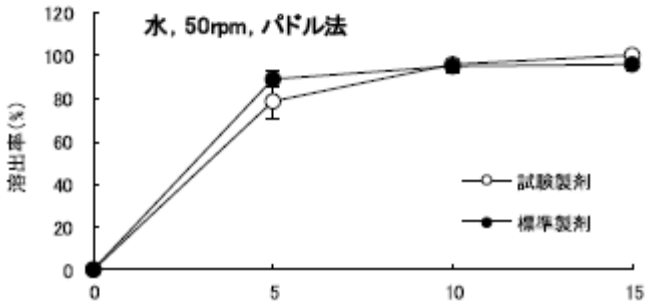
各時間(分)における溶出率(%)

時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	78.3	99.7	104.1
標準偏差	0	4.3	2.1	2.0
標準製剤	0	80.5	90.7	94.4
標準偏差	0	16.6	6.2	3.4



各時間(分)における溶出率(%)

時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	73.8	97.6	102.0
標準偏差	0	5.6	2.4	2.3
標準製剤	0	74.6	85.0	87.3
標準偏差	0	12.1	5.5	5.5



各時間(分)における溶出率(%)

時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	78.9	95.8	100.7
標準偏差	0	8.6	2.4	1.8
標準製剤	0	89.4	94.9	96.0
標準偏差	0	4.0	2.9	2.9

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較（パドル法）

試験条件			平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)	試験製剤	標準製剤			
50	pH1.2	15	98.0	94.0	4.0	15 分以内に平均 85%以上溶出	適
	pH3.0	15	104.1	94.4	9.7		適

	pH6.8	15	102.0	87.3	14.7		適
	水	15	100.7	96.0	4.7		適

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。
従って、ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

販売名	包装形態	内容量（重量、用量又は個数等）
ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」	PTP 包装	60 錠［10 錠×6］
ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」	PTP 包装	60 錠［10 錠×6：乾燥剤入り］

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

販売名	包装形態	材質
ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」	PTP 包装	PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔
ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」	PTP 包装	PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔
		ピロー：アルミニウム・ポリエチレンラミネート

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

Ⅴ. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果
○子宮内膜症
○子宮腺筋症に伴う疼痛の改善

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量
通常、成人にはジエノゲストとして 1 日 2mg を 2 回に分け、月経周期 2～5 日目より経口投与する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意
治療に際しては妊娠していないことを確認し、必ず月経周期 2～5 日目より投与を開始すること。また、治療期間中は非ホルモン性の避妊をさせること。[2.2、9.5 参照]

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

〈子宮内膜症〉

国内第 III 相試験

月経時の自覚症状、月経時以外の自覚症状、他覚所見の全てを有する子宮内膜症患者 255 例を対象とした二重盲検比較試験（ジエノゲスト 2mg/日、24 週間投与）におけるジエノゲストの「全般改善度（投与終了時）」の「改善」以上の改善率は 78.1%（100/128 例）であった。また、ジエノゲストの「月経時以外の自覚症状の概括改善度（投与終了時）」の「改善」以上の改善率は 80.5%（103/128 例）、「他覚所見の概括改善度（投与終了時）」の「改善」以上の改善率は 78.1%（100/128 例）、「月経時の自覚症状の概括改善度（再来月経終了時）」の「改善」以上の改善率は 63.3%（81/128 例）であった。

副作用発現頻度は、ジエノゲスト投与群で100%（129/129例）であった。ジエノゲスト投与群の主な副作用は、不正子宮出血94.6%（122/129例）、ほてり49.6%（64/129例）、頭痛24.8%（32/129例）であった。[5)]

〈子宮腺筋症に伴う疼痛の改善〉

国内第III相試験

子宮腺筋症患者67例を対象としたプラセボ対照二重盲検比較試験（ジエノゲスト2mg/日、16週間投与）では、「子宮体部の最大径が10cm（新生児頭大）以上又は子宮筋層最大厚4cm以上の患者」及び「ヘモグロビン値8.0g/dL未満の患者」を除外し、「ヘモグロビン値8.0g/dL以上11.0g/dL未満の患者」はジエノゲスト投与前に貧血に対する治療を実施し、ヘモグロビン値11.0g/dL以上に改善した症例のみを登録した。ジエノゲストの疼痛スコア変化量（平均値±標準偏差）は-3.8±1.9（34例）であり、プラセボ群の-1.4±1.8（33例）に対する優越性が検証された（p＜0.001、投与前の疼痛スコアを共変量とした共分散分析）。

副作用発現頻度は、100%（34/34例）であった。主な副作用は、不正子宮出血97.1%（33/34例）、ほてり5.9%（2/34例）であった。[6)]

2）安全性試験

〈子宮内膜症〉

国内第III相長期投与試験

月経時の自覚症状、月経時以外の自覚症状、他覚所見の全てを有する子宮内膜症患者135例を対象とした長期投与試験（ジエノゲスト1～4mg/日、52週間投与[注)]）におけるジエノゲストの「全般改善度」の「改善」以上の改善率は投与24週、投与52週で各々72.5%（95/131例）、90.6%（106/117例）であった。また、ジエノゲストの「月経時以外の自覚症状の概括改善度」の「改善」以上の改善率は投与24週、投与52週で各々77.9%（102/131例）、84.6%（99/117例）、「他覚所見の概括改善度」の「改善」以上の改善率は投与24週、投与52週で各々78.6%（103/131例）、94.9%（111/117例）、「月経時の自覚症状の概括改善度（再来月経終了時）」の「改善」以上の改善率は65.9%（89/135例）であった。

副作用発現頻度は、88.9%（120/135例）であった。主な副作用は、不正子宮出血71.9%（97/135例）、頭痛18.5%（25/135例）、便秘10.4%（14/135例）であった。[7)、8)]

注）本剤の承認された用法及び用量は「1日2mgを2回に分け経口投与」であるが、本試験は症状に応じて適宜増減可能（1～4mg）とした。

〈子宮腺筋症に伴う疼痛の改善〉

国内第III相長期投与試験

子宮腺筋症患者130例を対象とした長期投与試験（ジエノゲスト2mg/日、52週間投与）においても、国内第III相試験と同じ除外基準を設定した。ジエノゲストの疼痛スコア変化量は、投与24週時に-3.4±1.8（122例）、投与52週時に-3.8±1.5（118例）であった。

副作用発現頻度は、97.7%（127/130例）であった。主な副作用は、不正子宮出血96.9%（126/130例）、ほてり7.7%（10/130例）、閉経期症状4.6%（6/130例）であった。[9)]

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1）使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2）承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

プロゲステロン、ジドロゲステロン、メドロキシプロゲステロン酢酸エステル、ヒドロキシプロゲステロンカプロン酸エステル
注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ジエノゲストはプロゲステロン受容体に対する選択的なアゴニスト作用を示し、卵巣機能抑制及び子宮内膜細胞の増殖抑制により子宮内膜症に対する有効性及び子宮腺筋症に伴う疼痛の改善を示すと考えられる。[10)]

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) ステロイドホルモン受容体に対する作用

① 受容体アゴニスト活性

ヒトステロイドホルモン受容体遺伝子を導入した細胞を用いた *in vitro* 試験で、プロゲステロン受容体に対する選択的なアゴニスト活性を示した。[11)-14)]

② プロゲステロン作用

ラット及びウサギを用いた *in vivo* 試験において、子宮に対してプロゲステロン作用を示した。一方、アンドロゲン作用、グルココルチコイド作用及びミネラルコルチコイド作用は示さなかった。[15)-20)]

2) 卵巣機能抑制作用

① 健康成人女性

健康成人女性にジエノゲスト 1 日 2mg を 2 回に分け 21 日間経口投与したとき、通常の月経周期にみられる血清中エストラジオール及びプロゲステロン濃度の上昇の抑制、血清中 LH 及び FSH 濃度の一過性の上昇の消失が認められた。[21)]

② 子宮内膜症患者

子宮内膜症患者にジエノゲスト 1 日 1～4mg を 2 回に分け 16～24 週間経口投与[注)] したとき、血清中エストラジオール濃度は用量の増量に伴い低値を示した。また、ジエノゲスト 1 日 1～4mg [注)] で、血清中プロゲステロン濃度は全例で卵胞期の基準値以下であり、排卵抑制が示唆された。[22)]

注）本剤の承認された用法及び用量は「1 日 2mg を 2 回に分け経口投与」である。

③ 子宮腺筋症患者

子宮腺筋症患者にジエノゲスト 1 日 1mg、2mg 又はプラセボを 2 回に分け 16 週間経口投与[注)] したとき、血清中エストラジオール濃度は用量の増量に伴い低値を示した。また、ジエノゲスト 1 日 2mg で血清中エストラジオール濃度はプラセボに比し低値であり、血清中エストラジオール濃度抑制作用が認められた。[6), 23)]

注）本剤の承認された用法及び用量は「1 日 2mg を 2 回に分け経口投与」である。

3) 子宮内膜への作用

① 子宮内膜細胞の増殖抑制作用

ヒト子宮内膜間質細胞を用いた *in vitro* 試験で、細胞増殖の抑制が認められた。[24)]

② 子宮内膜の偽脱落膜化

子宮内膜症患者を対象とした臨床薬理試験で、ジエノゲスト 1 日 2mg を 2 回に分け 16 週間経口投与したとき、

ジエノゲストのプロゲステロン作用による子宮内膜の偽脱落膜化が認められた。[25)]

4) 実験的子宮内膜症に対する効果

ラット及びウサギを用いた実験的子宮内膜症の試験で、移植子宮内膜片の体積縮小あるいは重量の増加抑制がみられ、子宮内膜症に対する治療効果が示唆された。[26), 27)]

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

1) 単回投与

健康成人女性にジエノゲスト 0.5mg、1mg、2mg を絶食単回経口投与[注)] したときの薬物動態パラメータは以下のとおりであり、血漿中濃度は、投与後 0.9～1.3 時間で最高血漿中濃度に達した。Cmax 及び $AUC_{0-\infty}$は用量に依存して増大し、半減期は 6.65～7.66 時間であった。[28)]

単回投与時の薬物動態パラメータ

投与量	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2\alpha}$ (hr)	$t_{1/2\beta}$ (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)
0.5mg	17.5±2.2	0.9±0.2	0.749±0.201	7.06±1.00	154.9±34.2
1mg	34.7±3.1	1.3±0.6	0.772±0.364	6.65±1.49	320.4±56.7
2mg	76.1±14.6	1.2±0.4	0.580±0.209	7.66±1.22	695.1±114.2

(Mean±S.D.、n=6)

注）本剤の承認された用法及び用量は「1 日 2mg を 2 回に分け経口投与」である。

2) 反復投与

健康成人女性にジエノゲスト 0.5mg、1mg、2mg を 1 日 2 回 12 時間毎に 11 回（6 日間）反復経口投与[注)] したところ、血漿中濃度は投与回数に従い徐々に上昇し、いずれの用量においても投与回数 6 回でほぼ定常状態に達した。ジエノゲスト 1mg を 1 日 2 回反復経口投与したときの薬物動態パラメータは以下のとおりである。[29), 30)]

反復投与時（1mg×2 回/日）の薬物動態パラメータ

投与回数	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2\beta}$ (hr)	AUC[a)] (ng・hr/mL)
1 回目	28.0±3.2	2.1±0.9	8.56±1.91	313.5±29.2
11 回目	42.9±2.7	2.7±0.5	12.44±3.17	341.2±31.5

(Mean±S.D.、n=6)

a）1 回目の AUC は無限大時間まで外挿した値。11 回目は投与 12 時間後までの値。

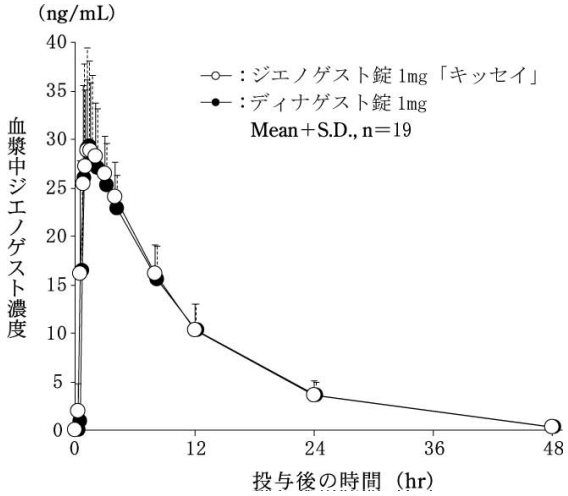
また、子宮内膜症患者 134 例にジエノゲスト 1 日 2mg を 2 回に分け 16 週間又は 24 週間経口投与したときの Cmax 及び $AUC_{0-\infty}$の推定値はそれぞれ 42.3ng/mL、393.9ng・hr/mL であった。[31)]

注）本剤の承認された用法及び用量は「1 日 2mg を 2 回に分け経口投与」である。

3) 生物学的同等性試験

〈ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」〉

ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」とディナゲスト錠 1mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ジエノゲストとして 1mg）健康成人女性（n=19）に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。[3)]



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-48} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」	361.2±73.0	33.07±5.88	1.724±1.010	7.74±1.83
ディナゲスト錠 1mg	352.9±70.5	33.78±5.67	1.658±1.675	8.00±1.71

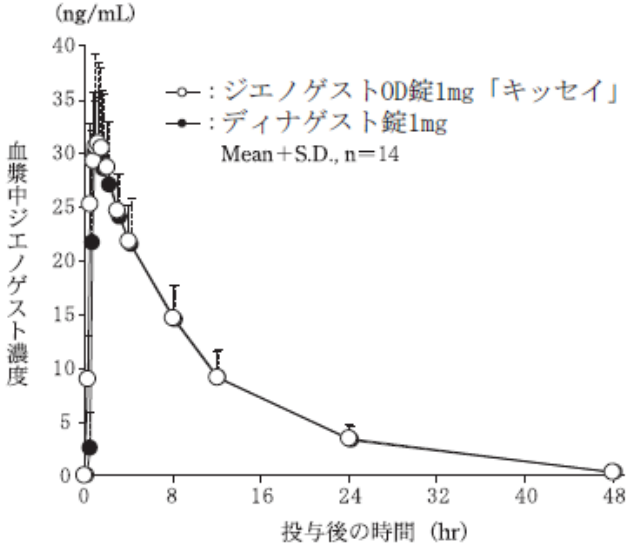
（Mean±S.D.、n=19）

血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

〈ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」〉

ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」とディナゲスト錠 1mg（普通錠）を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ジエノゲストとして 1mg）健康成人女性に絶食単回経口投与（水なしで服用（n＝14）及び水で服用（n＝16））して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。[4)]

① 水なしで服用（ディナゲスト錠 1mg は水で服用）

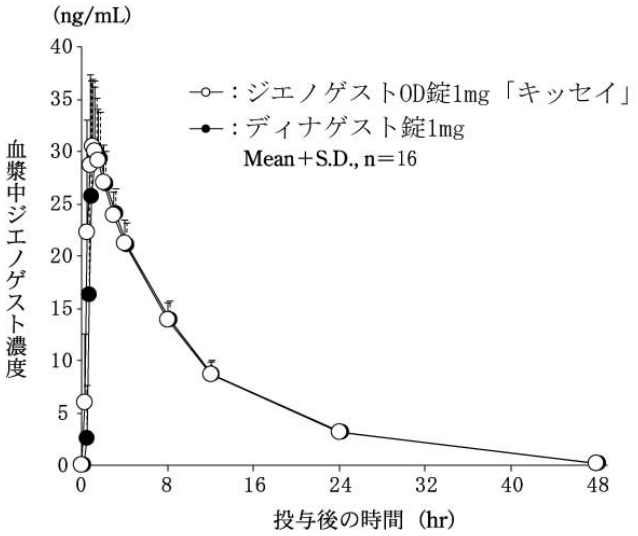


	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-48} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」	342.7±75.2	33.27±4.71	1.071±0.385	8.30±1.79
ディナゲスト錠 1mg	334.1±77.0	35.13±4.38	1.232±0.890	8.15±1.60

(Mean±S.D.、n=14)

血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

② 水で服用



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-48} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」	321.1±42.4	32.80±6.05	1.328±0.751	7.589±1.138
ディナゲスト錠 1mg	317.9±38.7	33.20±5.24	1.313±0.609	7.754±1.110

(Mean±S.D.、n=16)

血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

健康成人女性にジエノゲスト 0.5mg、1mg、2mg を単回経口投与[注)] したとき、摂食による吸収の遅延は認められるものの、吸収率及び消失速度には影響せず、食事の影響は少ないと考えられた。[28)-30)]

絶食下及び非絶食下の薬物動態パラメータ

投与量	投与条件	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2\beta}$ (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)
0.5mg	絶食下	17.5±2.2	0.9±0.2	7.06±1.00	154.9±34.2
	非絶食下	12.4±0.4	2.3±1.0	8.82±1.48	166.5±39.5
1mg	絶食下	34.7±3.1	1.3±0.6	6.65±1.49	320.4±56.7
	非絶食下	28.0±3.2	2.1±0.9	8.56±1.91	313.5±29.2

投与量	投与条件	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2\beta}$ (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)
2mg	絶食下	76.1±14.6	1.2±0.4	7.66±1.22	695.1±114.2
	非絶食下	52.0±8.2	3.5±0.5	7.47±0.36	625.4±73.9

(Mean±S.D.、n=6)

注）本剤の承認された用法及び用量は「1日2mgを2回に分け経口投与」である。

2）併用薬の影響

「Ⅷ．7．相互作用」の項参照

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

販売名	kel	
ジエノゲスト錠1mg「キッセイ」[3]	0.0938±0.0192hr^{-1} (健康成人女性、絶食単回経口投与)	
ジエノゲストOD錠1mg「キッセイ」[4]	水なしで服用	水ありで服用
	0.0874±0.0194hr^{-1} (健康成人女性、絶食単回経口投与)	0.0932±0.0132hr^{-1} (健康成人女性、絶食単回経口投与)

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

健康成人女性6例にジエノゲスト0.5mg及び1mgを絶食単回経口投与[注]したときのみかけの分布容積（Vdβ/F）は、それぞれ33.79L及び30.04Lであった。[28]

注）本剤の承認された用法及び用量は「1日2mgを2回に分け経口投与」である。

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

(1) 生物学的利用率

健康成人男性20例にジエノゲスト2mgを絶食単回経口投与（錠剤）及び静脈内投与[注]したとき、生物学的利用率は90.55%であった（外国人データ）。[32]

注）本剤の承認された用法及び用量は「1 日 2mg を 2 回に分け経口投与」である。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

「Ⅷ. 6.（5）妊婦」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 6.（6）授乳婦」の項参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

健康成人女性の血漿を用いた *in vitro* 試験におけるジエノゲスト（100ng/mL）の蛋白結合率は 94.5%であった。結合蛋白質は主にアルブミンと考えられた。[33), 34)]

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

ヒト肝ミクロソームを用いた *in vitro* 試験の結果より、ジエノゲストの代謝には、主に CYP3A4 が関与すると考えられた。[35), 36)]

また、健康成人女性 6 例にジエノゲスト 2mg を 1 日 2 回、計 11 回（6 日間）反復経口投与[注)]したときの定常状態における Cmax の 368 倍の濃度（100μmol/L）においても、ジエノゲストは CYP1A2、CYP2C9、CYP2C19、CYP2D6、CYP2E1、CYP3A4 活性をほとんど阻害しなかった。[37), 38)]

注）本剤の承認された用法及び用量は「1 日 2mg を 2 回に分け経口投与」である。

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

「Ⅶ. 4. 吸収」の項参照

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

健康成人女性 6 例にジエノゲスト 2mg を絶食単回経口投与[注)] した場合、尿中に未変化体は検出されず、尿中の代謝物として主に水酸化体及びグルクロン酸抱合体が排泄された。[28)]

注）本剤の承認された用法及び用量は「1 日 2mg を 2 回に分け経口投与」である。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

「Ⅷ．6．(3) 肝機能障害患者」の項参照

11. その他

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2.禁忌（次の患者には投与しないこと）
2.1 診断のつかない異常性器出血のある患者［類似疾患（悪性腫瘍等）のおそれがある。］［8.1 参照］
2.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性［7.、9.5 参照］
2.3 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2.4 高度の子宮腫大又は重度の貧血のある患者［不正子宮出血が増悪し、大量出血を起こすおそれがある。］［8.4、11.1.1、17.1.3、17.1.4 参照］

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「Ⅴ．４．用法及び用量に関する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

8.重要な基本的注意
8.1 本剤の投与に際しては、類似疾患（悪性腫瘍等）との鑑別に留意し、投与中に腫瘤が増大したり、臨床症状の改善がみられない場合は投与を中止すること。［2.1 参照］
8.2 卵巣チョコレート嚢胞は、頻度は低いものの自然経過において悪性化を示唆する報告があるので、定期的に画像診断や腫瘍マーカー等の検査を行い、患者の状態に十分注意すること。
8.3 本剤投与中は経過を十分に観察し、期待する効果が得られない場合には漫然と投与を継続せず、他の適切な治療を考慮すること。
8.4 本剤投与後に不正子宮出血があらわれ、重度の貧血に至ることがある。不正子宮出血の程度には個人差があり、投与中に出血が持続する場合や一度に大量の出血が生じる場合もあるので、以下の点に注意すること。［2.4、11.1.1 参照］
・患者にはあらかじめ十分に説明し、出血量が多く持続日数が長い場合や一度に大量の不正子宮出血が認められた場合には、医師へ相談するよう指導すること。
・貧血のある患者では、必要に応じて本剤投与前に貧血の治療を行うこと。
・不正子宮出血が認められた場合には必要に応じて血液検査を実施し、患者の状態を十分に観察すること。異常が認められた場合には鉄剤の投与又は本剤の投与中止、輸血等の適切な処置を行うこと。
・子宮内膜症患者を対象とした国内臨床試験において、子宮腺筋症又は子宮筋腫を合併する患者での貧血の発現率は、合併しない患者と比較して高い傾向が認められている。
8.5 本剤を長期投与する場合には以下の点に注意すること。
・不正子宮出血が持続的に認められている患者は、類似疾患（悪性腫瘍等）に起因する出血との鑑別に留意し、定期的に画像診断等を行うなど、患者の状態に十分注意すること。また、必要に応じ細胞診等の病理学的検査の実施を考慮すること。
・本剤の１年を超える投与における有効性及び安全性は確立していないので、１年を超える投与は治療上必要と判断される場合にのみ行い、定期的に臨床検査（血液検査、骨塩量検査等）等を行うなど、患者の状態に十

分注意すること。
8.6 本剤の投与により更年期障害様のうつ症状を起こすことが報告されているので、本剤の使用に際しては患者の状態等を十分に観察すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 子宮筋腫のある患者

不正子宮出血が増悪し、まれに大量出血を起こすおそれがある。

9.1.2 うつ病又はうつ状態の患者並びにそれらの既往歴のある患者

更年期障害様のうつ症状があらわれるおそれがある。

9.1.3 最大骨塩量に達していない患者

本剤投与に際し、本剤投与による骨密度の減少の可能性や将来的な骨粗鬆症等の発症リスクを考慮した上で、本剤の投与の可否を慎重に判断すること。また、本剤投与中は、定期的に骨塩量検査を実施するなど患者の状態に十分注意し、治療上の有益性と骨密度減少のリスクを考慮した上で投与継続の可否を慎重に判断し、漫然と投与しないこと。12 歳～18 歳を対象とした海外臨床試験において、本剤 52 週間投与後の骨密度変化率は-1.2%であった。[39] ［9.7 参照］

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

代謝能の低下により、本剤の作用が増強することがある。重度の肝機能障害患者は臨床試験では除外されている。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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。動物実験（ラット、ウサギ）において、受胎阻害、胚死亡率の増加及び流産等が認められている。［2.2、7.参照］

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。動物実験（ラット）において、乳汁中に移行することが報告されている。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。［9.1.3 参照］

(8) 高齢者

設定されていない

7. 相互作用

10. 相互作用

本剤は主に CYP3A4 で代謝される。［16.4 参照］

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
CYP3A4 阻害剤 エリスロマイシン クラリスロマイシン アゾール系抗真菌剤 イトラコナゾール フルコナゾール　等 ［16.7.1 参照］	本剤の血中濃度が上昇するおそれがある。(本剤とクラリスロマイシンの併用により、本剤の Cmax 及び AUC はそれぞれ単独投与時の 20%及び 86%増加した。)	これらの薬剤が本剤の薬物代謝酵素である CYP3A4 を阻害することによると考えられる。
CYP3A4 誘導剤 リファンピシン フェニトイン フェノバルビタール カルバマゼピン　等	本剤の血中濃度が低下することにより本剤の有効性が減弱するおそれがある。	これらの薬剤が本剤の薬物代謝酵素である CYP3A4 を誘導することによると考えられる。
卵胞ホルモン含有製剤 エストラジオール誘導体 エストリオール誘導体 結合型エストロゲン製剤　等	本剤の効果が減弱する可能性がある。	子宮内膜症はエストロゲン依存性の疾患であることから、卵胞ホルモン含有製剤の投与により本剤の治療効果が減弱する可能性がある。
黄体ホルモン含有製剤 プロゲステロン製剤 メドロキシプロゲステロン酢酸エステル製剤 ノルエチステロン製剤 ジドロゲステロン製剤　等	プロゲステロン作用が増強する可能性がある。	ともにプロゲステロン受容体に対するアゴニスト活性を示すことから、プロゲステロン作用が相加的に増強する可能性がある。

（解説）

〈クラリスロマイシン〉

健康成人女性 10 例にクラリスロマイシン 200mg を 1 日 2 回、3 日間経口投与し、翌日、ジエノゲスト 1mg とクラリスロマイシン 200mg を 1 回併用したとき、ジエノゲストの Cmax 及び $AUC_{0-\infty}$はジエノゲスト 1mg 単独投与時に比し、それぞれ 1.20 倍、1.86 倍に上昇した。[40)]

8. 副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 重篤な不正子宮出血（頻度不明）**、重度の貧血**（頻度不明）

本剤投与後に不正子宮出血があらわれ、重度の貧血に至ることがある。出血量が多く持続日数が長い場合や一度に大量の不正子宮出血が認められた場合には、必要に応じて血液検査を実施し、観察を十分に行うこと。異常が認められた場合には、鉄剤の投与又は本剤の投与中止、輸血等の適切な処置を行うこと。[2.4、8.4 参照]

11.1.2 アナフィラキシー（頻度不明）

アナフィラキシー（呼吸困難、血管浮腫、蕁麻疹、そう痒感等）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投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	1～5%未満	1%未満
低エストロゲン症状	ほてり(20.6%)、頭痛	めまい、動悸	不眠、発汗、不安、抑うつ
子宮	不正子宮出血(88.3%)	腹痛	
乳房		乳房緊満感、乳房痛	乳汁分泌
皮膚	外陰部かぶれ・かゆみ注)	ざ瘡	脱毛、皮膚乾燥
精神神経系		傾眠	いらいら感、片頭痛、しびれ感
過敏症		発疹等	そう痒感
肝臓		AST・ALT・γ-GTP・ビリルビン上昇等の肝機能検査値異常	
消化器	悪心	腹痛、便秘、下痢、胃部不快感、腹部膨満感	嘔吐、口内炎
血液		貧血	白血球減少
筋骨格系		背部痛、骨塩量低下、肩こり	関節痛
その他		倦怠感、体重増加、浮腫、疲労	発熱、コレステロール上昇、耳鳴、血糖値上昇

注）不正子宮出血の持続により、このような症状があらわれることがある。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

〈ジエノゲスト錠 1mg「キッセイ」〉

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

〈ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」〉

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

14.1.2 本剤は舌の上にのせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

14.1.3 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

「Ⅷ. 6. (5) 妊婦」の項参照

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製　　剤：処方箋医薬品[注)]
　　注）注意－医師等の処方箋により使用すること。
有効成分：該当しない

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

〈ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」〉

20. 取扱い上の注意 アルミピロー開封後は遮光して保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり
くすりのしおり：あり
その他の患者向け資材：
・子宮腺筋症 ジエノゲスト錠・OD 錠 1mg「キッセイ」を服用される方へ
・Notebook 体調記録
・ジエノゲスト錠 1mg・OD 錠 1mg「キッセイ」を服用されている方へ
　キッセイ薬品工業株式会社ホームページ https://med.kissei.co.jp/ 参照

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：ディナゲスト錠 1mg、ディナゲスト OD 錠 1mg

7. 国際誕生年月日

2007年10月31日（日本）

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

履歴	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
ジエノゲスト錠 1mg 「キッセイ」	2017 年 2 月 15 日	22900AMX00355000	2017 年 6 月 16 日	2017 年 6 月 16 日
ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」	2017 年 8 月 15 日	22900AMX00905000	2017 年 12 月 8 日	2017 年 12 月 8 日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

〈ジエノゲスト錠 1mg/OD 錠 1mg「キッセイ」〉

効能・効果追加年月日：2021 年 3 月 24 日

内容：以下の下線部分を追加した。

	旧	新
効能・効果	子宮内膜症	○子宮内膜症 ○子宮腺筋症に伴う疼痛の改善

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード（YJ コード）	HOT（9 桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
ジエノゲスト錠 1mg 「キッセイ」	2499010F1082	2499010F1082	125343601	622534301
ジエノゲスト OD 錠 1mg「キッセイ」	2499010F2054	2499010F2054	125836301	622583601

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

1) 社内資料：安定性試験（普通錠）
2) 社内資料：安定性試験（OD 錠）
3) 社内資料：生物学的同等性試験（普通錠）
4) 社内資料：生物学的同等性試験（OD 錠）
5) 原田 省 他：薬理と治療. 2008；36(2)：129-140
6) Osuga,Y.et al.：Fertil.Steril. 2017；108(4)：673-678
7) 長期投与試験－子宮内膜症患者における長期投与の有効性および安全性の検討－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.6.8）
8) 全試験を通しての結果の比較と解析
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
9) Osuga,Y.et al.：J.Obstet.Gynaecol.Res. 2017；43(9)：1441-1448
10) 作用機序（ディナゲスト錠・OD 錠：2016 年 12 月 2 日承認、申請資料概要 2.6.2）
11) 薬理試験－ヒトプロゲステロン・アンドロゲンおよびグルココルチコイド受容体に対するアゴニスト活性の検討－（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
12) 薬理試験－ヒトエストロゲン受容体に対するアゴニスト活性の検討－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
13) 薬理試験－ヒトミネラルコルチコイド受容体に対するアゴニスト活性およびアンタゴニスト活性の検討－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
14) 薬理試験－ヒトアンドロゲンおよびグルココルチコイド受容体に対するアンタゴニスト活性の検討－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
15) 薬理試験－エストロゲンを投与したラットの子宮重量増加に及ぼす影響－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
16) 薬理試験－エストロゲンを投与したラットにおける子宮重量増加抑制作用の機序検討－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
17) 薬理試験－ウサギ子宮腺の発達に及ぼす影響（McPhail 試験）－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
18) 薬理試験－ラットを用いたアンドロゲン作用の検討－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.3）
19) 薬理試験－ラットを用いたグルココルチコイド作用の検討－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.3）
20) 薬理試験－ラットを用いたミネラルコルチコイド作用の検討－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.3）
21) 臨床薬理試験－健康成人女性におけるホルモン動態試験－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.6.5）
22) 臨床薬理試験－子宮内膜症患者におけるホルモン動態試験－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
23) 大須賀 穣 他：薬理と治療. 2017；45(6)：907-920
24) 薬理試験－ヒト子宮内膜間質細胞の増殖に及ぼす影響－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
25) Irahara,M.et al.：Reprod.Med.Biol. 2007；6(4)：223-228
26) 薬理試験－ラット子宮内膜自家移植モデルにおける有効性－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
27) 薬理試験－ウサギ子宮内膜自家移植モデルにおける有効性－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
28) 第Ⅰ相試験－単回投与試験－（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.6.3）

29) 第Ⅰ相試験－反復投与試験－（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.6.3）
30) 第Ⅰ相試験－反復投与追加試験－（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.6.3）
31) 臨床薬物動態試験－子宮内膜症患者を対象とした母集団薬物動態解析－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
32) 海外臨床薬物動態試験－健康成人男性における生物学的利用率の検討－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.6.1）
33) 薬物動態試験－ヒト血漿たん白結合(1)－（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.4.4）
34) 薬物動態試験－ヒト血漿たん白結合(2)－（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
35) 薬物動態試験－代謝に関与する CYP 分子種の検討(1)－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.4.5）
36) 薬物動態試験－代謝に関与する CYP 分子種の検討(2)－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.4.5）
37) 薬物動態試験－CYP 分子種に対する阻害作用の検討(1)－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.4.7）
38) 薬物動態試験－CYP 分子種に対する阻害作用の検討(2)－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.6.4.7）
39) Ebert,A.D.et al.：J.Pediatr.Adolesc.Gynecol. 2017；30(5)：560-567
40) 臨床薬物動態試験－クラリスロマイシン併用の薬物相互作用－
（ディナゲスト錠：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.6.4）

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

該当資料なし

2. その他の関連資料

患者さん向け情報サイト：https://www.kissei.co.jp/dienogest/select.php