

戊酸雌三醇 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文  
[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/313/2021\\_2022\\_\\_E6\\_88\\_8A\\_E9\\_85\\_B8\\_E9\\_9B\\_8C\\_E4\\_c22\\_313692.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E6_88_8A_E9_85_B8_E9_9B_8C_E4_c22_313692.htm) 药品名称戊酸雌三醇  
药物别名协坤 英文名称estradiol valerate 类别雌激素及其类似  
合成药物制剂片剂，0.5mg 分子式成分3-羟基雌甾-1，3，5  
(10)三烯-17 醇-17-戊酸酯。白色，无臭，在乙醇、丙酮  
或氯仿中易溶，在植物油中微溶，在水中几乎不溶。药理毒  
理本品为天然雌二醇的戊酸盐，属天然雌激素，具有雌二醇  
的药理作用，能促进和调节女性生殖器官和第二性征的正常  
发育。使血清雌二醇水平升高，用药后达到激素补充治疗  
(HRT)中有效雌激素浓度(220pmolL<sup>-1</sup>)，相当于正常早  
、中卵泡期的平均雌激素水平；对垂体促卵泡激素(FSH)  
的释放有抑制作用，用药4个周期血清FSH水平明显下降；对  
雌激素缺乏引起的症状有明显的疗效。北京协和医院对该药  
作了临床评价，选择有HRT适应证的妇女86例，口服协  
坤1mgd<sup>-1</sup> 醋甲羟孕酮(MPA)2mgd<sup>-1</sup> 钙500mgd<sup>-1</sup>，其中70例  
(81.4%)完成1年的治疗，治疗后症状缓解率为68.7%，ALP  
、空腹尿Ca/Cr、空腹尿Ntx(Ⅰ型胶原氨基端肽)/Cr的下降  
率分别为7.4%，40.3%和35.4%。治疗后骨密度上升率在第2  
~4腰椎为4.5%，在股骨颈为3.4%。此结果表明，国产戊酸  
雌二醇可有效改善绝经症状，预防低骨量绝经后妇女继续骨  
丢失。药动学口服迅速吸收，经消化道及肝脏代谢为17-  
雌二醇。单次口服2mg，1~3h后血清中17-雌二醇达峰值  
为330~514pmolL<sup>-1</sup>，持续5h后降至147~220pmolL<sup>-1</sup>，并维  
持24h。3H标记放射性核素试验表明，本品在24h内大部分由  
尿和粪便排泄。适应症绝经后的更年期症状，或卵巢切除后

及非癌性放射性治疗后的雌激素不足的症状，如潮热、阵发性出汗、睡眠障碍、情绪抑郁、易怒、头痛及头晕等。不良反应少数病例可有乳房胀感、胃部不适、恶心、头痛、体重增加及子宫出血。说明北京大学第一医院、首都医科大学附属朝阳医院和卫生部北京医院进行临床验证，病例选择标准：年龄40~65岁；自然经绝经半年以上或人工绝经术后；有潮热等更年期症状要求治疗；血清雌二醇 $gt.40\text{mIUmL}^{-1}$ ；3个月内未用HRT或其他针对更年期症状的药物，答应用维生素类、钙剂和抗高血压药物。入选患者150例，随机分成试验组100例和对照组50例。试验组服用戊酸雌二醇（北京协和药厂，批号：950628，每片0.5mg） $1\text{mgd}^{-1}$ ，连续服用4个周期（每周期按28d计算），自周期d15~d28服用MPA $4\text{mgd}^{-1}$ 。对照组服用Premarin片（每片含0.625mg结合雌激素），每日1片，连续服用4个周期；MPA服法同试验组。【疗效评价】试验组与对照组的Kupperman评分在治疗1个月后均有极显著的下降，在治疗1，2，3，4个月的下降率试验组为59.0%，78.0%和91.5%；对照组为50.0%，78.2%和91.3%。2组症状总评分的下降情况相似，随着用药时间的延长，组症状总评分的下降情况相似，随着用药时间的延长，症状继续改善，且无显著差异。各种症状的完全缓解率、显效率和有效率在试验组中分别为81.8%，16.1%和2.1%，在对照组中分别为85.3%，12.2%和2.5%。2组无显著着异。2组在用药前后的阴道细胞成熟指数均有明显的改善，表、中层细胞数显著增加，底层细胞数减少。2组用药前后血清FSH水平均有极显著的下降，试验组从用药前的（ $101.00 \pm 25.19$ ）下降到用药后的（ $78.60 \pm 27.62$ ） $\text{IU}^{-1}$ ，对照组从用药前的（106.15

$\pm 29.58$ ) 下降到用药后的 ( $62.09 \pm 27.08$ ) IUL-1, 雌二醇水平试验组从用药前的 ( $11.44 \pm 36.17$ ) 升高到用药后的 ( $85.73 \pm 62.29$ ) pgmL-1, 对照组从用药前排 ( $12.36 \pm 22.65$ ) 升高到用药后的 ( $73.69 \pm 62.06$ ) pgmL-1, ( $P \leq 0.01$ ), LDL-C降低 ( $P \leq 0.05$ ), 对照组LDL-C降低 ( $P \leq 0.01$ ), 但总胆固醇无明显影响。 2组用药前后在体重、血压、乳腺方面均无明显变化, 子宫内膜厚度均未出现显著的差异。2组的不良反应主要表现为乳房胀痛、水肿、白带增多, 个别有胃肠反应和头痛。试验组发生率为58.8%, 对照组为57.1%, 发生率之间无统计学差异 ( $P > 0.05$ )。一般症状稍微, 2组中均有1例停药。 使用孕激素时出现撤退性出血情况在试验组92例中有53例发生, 在对照组41例中31例发生。以上结果说明, 国产戊酸雌二醇口服片是一种治疗绝经期征候群效果良好而且安全的药物。用法用量饭后吞服1mgd-1, 遵医嘱可酌情增减, 按周期序贯疗法, 每经过21d的治疗后, 须停药至少1周。

**注重事项** 出现下述情况应立即停药: 偏头痛或严重头痛、突发性感觉障碍、血栓性静脉炎或血栓栓塞的前发指征、胸部疼痛及紧缩感、发生黄疸、肝炎、全身痛痒、癫痫发作次数增多、血压显著增高等。 下述情况应告知医生: 规律的服用其他药物; 子宫出血; 个别良、恶性肿瘤患者服药后出现异常的上腹部症状。 糖尿病、高血压、静脉曲张、耳硬化症、多发性硬化、癫痫、血卟啉症、手足抽搐、小舞蹈病须在医生监护下用药。 患有子宫内膜增生应避免进行非对抗性的雌激素治疗。对有子宫的妇女另给予孕激素类药。

100Test 下载频道开通, 各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)