

蛋白質分解酵素阻害剤

劇薬
処方箋医薬品^注※**ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg [AFP]****GABEXATE MESILATE FOR INJECTION**

(注射用ガベキサートメシル酸塩)

貯 法：遮光、室温保存
使用期限：包装に表示の使用
期限内に使用す
ること。

※ 承認番号	22700AMX00264000
※ 薬価収載	2015年6月
販売開始	1984年7月
効能追加	1988年10月

注)注意-医師等の処方箋により使用すること

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】**1. 組成**本品は1バイアル中にガベキサートメシル酸塩(日局)
100 mgを含有する白色の凍結乾燥品である。**2. 製剤の性状**本品は白色の粉末又は塊で、においはなく、味は苦い。
本品は水に極めて溶けやすい。本品1バイアルを5%ブドウ糖注射液10mLに溶か
した液の浸透圧比(生理食塩液対比)は1.1~1.3である。
本品の水溶液(1→10)のpHは4.0~5.5である。**【効能又は効果】****1. 蛋白分解酵素(トリプシン、カリクレイン、プラスミン
等)逸脱を伴う下記諸疾患**急性膵炎
慢性再発性膵炎の急性増悪期
術後の急性膵炎**2. 汎発性血管内血液凝固症****【用法及び用量】****1. 膵炎には**通常、1回1バイアル(ガベキサートメシル酸塩とし
て100 mg)を5%ブドウ糖注射液又はリンゲル液を用
いて溶かし、全量500mLとするか、もしくはあらかじめ
注射用水5mLを用いて溶かし、この溶液を5%ブド
ウ糖注射液又はリンゲル液500mLに混和して、8mL/
分以下で点滴静注する。(1)原則として初期投与量は1日量1~3バイアル(溶解
液500~1,500mL)とし、以後は症状の消退に応じ減
量するが、症状によっては同日中に、さらに1~3
バイアル(溶解液500~1,500mL)を追加して点滴静注
することができる。

(2)症状に応じ適宜増減。

2. 汎発性血管内血液凝固症には通常、成人1日量ガベキサートメシル酸塩として20~
39 mg/kgの範囲内で24時間かけて静脈内に持続投与す
る。**【用法及び用量に関連する使用上の注意】****汎発性血管内血液凝固症には**本剤は高濃度で血管内壁を障害し、注射部位及び刺
入した血管に沿って静脈炎や硬結、潰瘍・壊死を起
こすことがあるので、末梢血管から投与する場合、
本剤100 mgあたり50mL以上の輸液(0.2%以下)で点
滴静注することが望ましい。**【使用上の注意】****1. 重要な基本的注意**ショック、アナフィラキシーショック、アナフィラキ
シーがあらわれることがあるので、十分な問診と救急
処置のとれる準備を行い、投与にあたっては観察を十
分に行い、血圧低下、発赤、痒痒、不快感、嘔気等の
症状があらわれた場合には直ちに投与を中止し、適切
な処置を行うこと。**2. 副作用**本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる
調査を実施していない。**(1)重大な副作用****1) ショック(頻度不明)、アナフィラキシーショック
(頻度不明)：**ショック、アナフィラキシーショッ
ク(血圧低下、呼吸困難、意識消失、咽・喉頭浮
腫等)があらわれることがあるので、異常が認め
られた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置
を行うこと。**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、咽・喉頭浮腫等)があらわれることが
あるので、異常が認められた場合には直ちに投与
を中止し、適切な処置を行うこと。**3) 注射部位の皮膚潰瘍・壊死(頻度不明)：**本剤の濃
度が高くなると、血管内壁を障害し、注射部位及
び刺入した血管に沿って静脈炎や硬結、潰瘍・壊
死を起こすことがあるので観察を十分に行い、注
射部位の血管痛、発赤、炎症等があらわれた場合
には投与部位の変更又は投与を中止し、適切な処
置を行うこと。**4) 無顆粒球症(頻度不明)、白血球減少(頻度不明)、
血小板減少(頻度不明)：**無顆粒球症、白血球減少、
血小板減少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
中止すること。**5) 高カリウム血症(頻度不明)：**高カリウム血症が
あらわれることがあるので、異常が認められた場
合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。**(2) その他の副作用**

	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、痒痒感等
出血傾向 ^{注2)}	出血傾向亢進
血液 ^{注1)}	顆粒球減少、好酸球増多
循環器	血圧低下
肝臓	AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇、黄疸、 総ビリルビン上昇等
その他	悪心、顔面潮紅、発熱、低ナトリウム血症

注1)：発現した場合には投与を中止すること。

注2)：発現した場合には減量又は投与を中止すること。

3. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため減量するなど注意すること。

4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には大量投与を避けること。[大量(100mg/kg/日)投与でマウスに胎児体重の増加の抑制が認められている。]

5. 適用上の注意

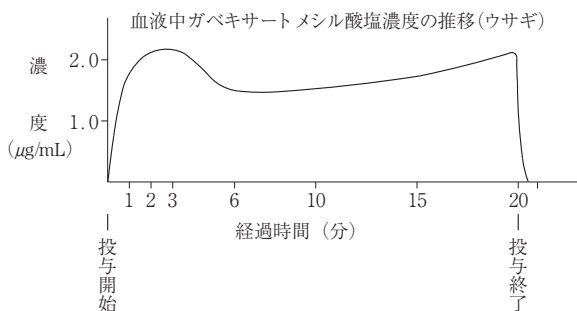
- (1) **投与速度**：点滴静注する場合、投与速度が増加すると血圧が低下することがあるので、ガベキサートメシル酸塩として体重1kg当たり毎時2.5mg以下とすることが望ましい。
- (2) **投与时**：薬液が血管外へ漏れると、注射部位に潰瘍・壊死を起こすことがあるので、薬液が血管外へ漏出しないよう注意すること。また、血液うっ滞が起こらないようできるだけ太い血管より投与すること。
- (3) **調製時**：
 - 1) 溶解後はなるべく速やかに使用すること。
 - 2) 他の注射剤(抗生物質製剤、血液製剤等)と配合した場合に、混濁等の配合変化を起こすことがあるので注意すること。また、アミノ酸輸液、アルカリ性の薬剤及び添加物として亜硫酸塩を含有する薬剤と配合した場合、分解等の配合変化を起こすことがあるので注意すること。

【薬物動態】

(参考：動物)

血中濃度¹⁾

健康なウサギにガベキサートメシル酸塩として1mg/kg/分で持続静脈内投与すると、血中濃度は投与開始直後より急速に上昇し、3分後に最高値に達し、その後6分迄は一旦減少した後、20分迄の投与継続中は再び漸増し、投与終了後急激に低下した。投与終了後の、血液中ガベキサートメシル酸塩の半減期は10秒であった。



【薬効薬理】

蛋白分解酵素阻害作用 (in vitro)²⁾

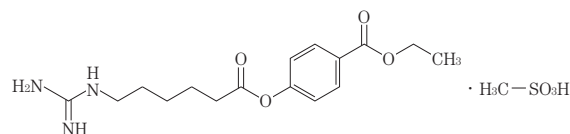
凝固系及び線溶系の酵素に対して強い阻害作用を示した。

特に、トロンビン、第Xa因子、血漿カリクレイン、プラスミン、ウロキナーゼ、トリプシンに対して μ Mオーダーのガベキサートメシル酸塩により非常に強い阻害作用を示した。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ガベキサートメシル酸塩(Gabexate Mesilate)

構造式：



化学名：Ethyl 4-(6-guanidinohexanoyloxy)benzoate monomethanesulfonate

分子式：C₁₆H₂₃N₃O₄ · CH₄O₃S

分子量：417.48

※※性 状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

水に極めて溶けやすく、エタノール(95)に溶けやすい。

融 点：90~93℃

【取扱い上の注意】

【安定性試験】

最終包装品を用いた加速試験(40℃、6ヵ月)の結果、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。³⁾

【包 装】

10バイアル

30バイアル

※※【主要文献】

- 1) 共創未来ファーマ(株)：血中ガベキサートメシル酸塩濃度の推移(ウサギ)(社内資料)
- 2) 久保木正明他：薬理と治療 12：4933(1984)
- 3) 共創未来ファーマ(株)：安定性に関する資料(社内資料)

※【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

アルフレッサ ファーマ株式会社 学術情報部
〒540-8575 大阪市中央区石町二丁目2番9号
TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212

alfresa

販 売 元 アルフレッサファーマ株式会社
大阪市中央区石町二丁目2番9号

※※製造販売元 共創未来ファーマ株式会社
東京都品川区広町1-4-4