

蛋白分解酵素阻害剤

劇薬
処方箋医薬品^注※**ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」****GABEXATE MESILATE FOR INJECTION**

(注射用ガベキサートメシル酸塩)

貯法：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	22700AMX00265000
※薬価収載	2015年6月
販売開始	1994年8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)500mg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50mL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】

汎発性血管内血液凝固症

【用法及び用量】

通常、成人1日量ガベキサートメシル酸塩として20~39mg/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100mg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、痒疹、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、痒疹感等
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	血圧降下
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ので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、薬液が血管外へ漏れ出さないよう注意すること。また、血液うっ滞が起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。

【薬効薬理】

蛋白分解酵素阻害作用(in vitro)¹⁾

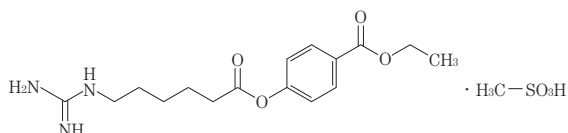
凝固系及び線溶系の酵素に対して強い阻害作用を示した。

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 μM 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-guanidinohexanoate)benzoate monomethanesulfonate

分子式： $\text{C}_{16}\text{H}_{23}\text{N}_3\text{O}_4 \cdot \text{CH}_4\text{O}_3\text{S}$

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。²⁾

【包装】

10バイアル

※※【主要文献】

1) 久保木正明他：薬理と治療 12：4933(1984)

2) 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