

貯法：室温保存
使用期限：外箱等に表示(3年)

承認番号	23000AMX00123
薬価収載	2018年6月
販売開始	1990年7月

蛋白分解酵素阻害剤

劇薬
処方箋医薬品
(注意-医師等の処方箋により使用する事)

** **ガベキサートメシル酸塩注射用500mg「タカタ」**

注射用ガベキサートメシル酸塩

GABEXATE MESILATE



【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

品名	ガベキサートメシル酸塩注射用500mg「タカタ」
成分・分量	1バイアル中 ガベキサートメシル酸塩 500mg

2. 製剤の性状

品名	ガベキサートメシル酸塩注射用500mg「タカタ」
性状	白色の塊である
pH	4.0~5.5(1.0g/10mL水溶液)
浸透圧比 (生理食塩液に対する比)	約1 500mg/5%ブドウ糖注射液500mL

【効能・効果】

汎発性血管内血液凝固症

【用法・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・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、瘙痒、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(頻度不明)

- 1) ショック、アナフィラキシーショック 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 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 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、白血球減少、血小板減少 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 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、瘙痒感等
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	血圧降下
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)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) 症状(異常)があらわれた場合には投与を中止すること。(太字)

注2) 症状があらわれた場合には減量又は投与を中止すること。(太字)

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あたり毎時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。

【臨床成績】

汎発性血管内血液凝固症(DIC)又はDIC準備状態の患者にガベキサートメシル酸塩注射用500mg「タカタ」(旧名称：レミナロン注射用500mg)を平均1日約1500mg連続投与した一般臨床試験における有効性評価対象例は52例であり、著明改善、改善例は6例(11.5%)、やや改善以上で31例(59.6%)であった。¹⁾

【薬効薬理】

薬理作用

1. トリプシン、プラスミン、カリクレイン、トロンビン、C1エステラーゼ、白血球エラスターゼ、膵エラスターゼ及びホスホリパーゼA₂阻害作用を示す(合成基質を用いた場合)。²⁾
2. 天然基質であるフィブリノーゲンを基質として用いた場合のトロンビン阻害作用はプラスミン阻害作用に比べて約10倍強い。²⁾

このことが抗凝固剤として汎発性血管内血液凝固症(DIC)治療に有用と考えられている。

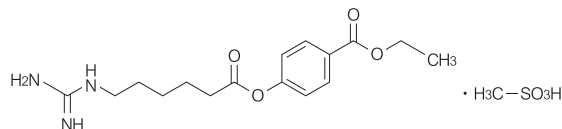
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ガベキサートメシル酸塩[日局]

Gabexate Mesilate

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

構造式：



分子式：C₁₆H₂₃N₃O₄・CH₃O₃S

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。

pH：1.0gを水10mLに溶かした液のpHは4.7~5.7である。

融点：90~93℃

【取扱い上の注意】

安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、36ヵ月)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ガベキサートメシル酸塩注射用500mg「タカタ」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。

【包装】*

ガベキサートメシル酸塩注射用500mg「タカタ」
10バイアル(ガラスバイアル)

【主要文献】

- 1) 財津昭憲他：社内資料(DIC患者における臨床成績)、1985。
- 2) 続木博茂他：基礎と臨床、22(5)：995、1988。
- 3) 高田製薬(株)社内資料(安定性)

【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。

高田製薬株式会社 学術部

〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

前回
改訂
⇒

製造販売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1