

貯法：室温保存
有効期間：3年

蛋白分解酵素阻害剤

注射用ガベキサートメシル酸塩

劇薬
処方箋医薬品^(注)

ガベキサートメシル酸塩 注射用100mg「サワイ」

GABEXATE MESILATE for Injection [SAWAI]

承認番号 22100AMX02313000

販売開始 1987年12月

(注)注意—医師等の処方箋により使用すること

2. 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

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分 [1バイアル中]	日局ガベキサートメシル酸塩 100mg
添加剤	pH調節剤

3.2 製剤の性状

剤形・性状	白色の凍結乾燥品、用時溶解して用いる注射剤
pH	4.0~5.5(100mg/mL水溶液)
浸透圧比 (生理食塩液に対する比)	約1(10mg/mL 5w/v%ブドウ糖注射液)

4. 効能又は効果

○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

○汎発性血管内血液凝固症

6. 用法及び用量

〈膵炎〉

通常、1回1バイアル(ガベキサートメシル酸塩として100mg)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500~1500mL)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500~1500mL)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。

〈汎発性血管内血液凝固症〉

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。

7. 用法及び用量に関連する注意

〈汎発性血管内血液凝固症〉

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。[11.1.3、14.1.2参照]

8. 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、そう痒、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。[11.1.1、11.1.2参照]

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には治療上の有益性が

危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。また、大量投与は避けること。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。¹⁾

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシーショック(いずれも頻度不明)

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。[8.参照]

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、咽・喉頭浮腫等)があらわれることがある。[8.参照]

11.1.3 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。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。[7.、14.1.2参照]

11.1.4 無顆粒球症、白血球減少、血小板減少(いずれも頻度不明)

11.1.5 高カリウム血症(頻度不明)

11.2 その他の副作用

	0.1~1%未満	頻度不明
過敏症	発疹、そう痒感等	
出血傾向		出血傾向亢進
血液		好酸球増多、顆粒球減少
循環器	血圧降下	
肝臓	黄疸、ASTの上昇等	総ビリルビン上昇、ALTの上昇等
その他	悪心	顔面潮紅、発熱、低ナトリウム血症

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 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。

14.1.2 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。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。[7.、11.1.3参照]

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

タンパク質分解酵素阻害作用を持ち、トリプシン、プラスミン、カリジノゲンナーゼ、トロンピン、C₁-エステラーゼに対し阻害作用を示す。また、Oddi括約筋弛緩作用、血液凝固因子阻害作用、汎発性血管内凝固因子消費抑制、血液線溶系酵素阻害による血小板凝集抑制作用も認められている²⁾。

19. 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)

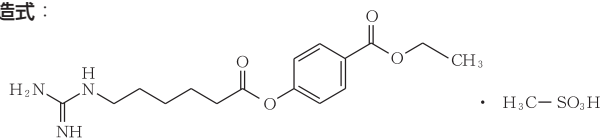
化学名：Ethyl 4-(6-guanidinohexanoyloxy)benzoate monomethanesulfonate

分子式：C₁₆H₂₃N₃O₄ · CH₃O₃S

分子量：417.48

融点：90～93℃

構造式：



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。

22. 包装

10バイアル

23. 主要文献

- 1) 藤田常夫他：応用薬理, 1975；9：743-760
- 2) 第十八改正日本薬局方解説書, 廣川書店, 2021；C-1341-1346

* 24. 文献請求先及び問い合わせ先

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-7708-8966

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30