

貯法：室温保存  
使用期限：外箱に表示の使用期限内  
に使用すること  
処方箋医薬品<sup>(注)</sup>

## 経口蛋白分解酵素阻害剤

日本標準商品分類番号  
873999

# ※カモスタットメシル酸塩錠100mg「フソー」

CAMOSTAT MESILATE Tab. 100mg

〈カモスタットメシル酸塩錠〉

承認番号	22500AMX00444000
薬価収載	2013年12月
販売開始	1996年7月
効能追加	2001年3月

### 【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】

販売名	カモスタットメシル酸塩錠100mg「フソー」			
成分・含量(1錠中)	カモスタットメシル酸塩 100mg (日局)			
色・剤形	白色～帯黄白色のフィルムコーティング錠			
添加物	結晶セルロース、カルメロース、ポビドン、ヒプロメロース、マクロゴール、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム			
外形	直径	厚さ	質量	識別コード
	6.6mm	3.8mm	124mg	DK321

### 【効能・効果】

- 慢性膵炎における急性症状の緩解
- 術後逆流性食道炎

### 【用法・用量】

- 慢性膵炎における急性症状の緩解には  
通常1日量カモスタットメシル酸塩として600mg(本剤6錠)を3回に分けて経口投与する。  
症状により適宜増減する。
- 術後逆流性食道炎には  
通常1日量カモスタットメシル酸塩として300mg(本剤3錠)を3回に分けて食後に経口投与する。

### 【使用上の注意】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)  
過敏症を有する患者〔過敏症を有していた場合、副作用が発現しやすくなる。〕
- 重要な基本的注意
  - 胃液吸引、絶食、絶飲等の食事制限を必要とする慢性膵炎の重症患者に本剤を投与しないこと。
  - 胃液の逆流による術後逆流性食道炎には、本剤の効果が期待できないので使用しないこと。
  - 術後逆流性食道炎に対しては症状の改善がみられない場合、長期にわたって漫然と投与しないこと。

### 3. 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、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、呼吸困難、痒痒感等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) **血小板減少**：血小板減少があらわれることがあるので、このような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。

- 肝機能障害、黄疸：AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -GTP、Al-Pの著しい上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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し、適切な処置を行うこと。
- 高カリウム血症：重篤な高カリウム血症があらわれることがあるので、血清電解質検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

#### (2) その他の副作用

	頻度不明
血液	白血球減少、赤血球減少、好酸球増多
過敏症 <sup>(注)</sup>	発疹、痒痒等
消化器	嘔気、腹部不快感、腹部膨満感、下痢、食欲不振、嘔吐、口渇、胸やけ、腹痛、便秘
肝臓	AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇等
腎臓	BUN、クレアチニンの上昇
その他	浮腫、低血糖

注) 発現した場合には投与を中止すること。

#### 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。〔ヒトの投与量の40倍(400mg/kg/日)以上を投与した動物実験(ラット)で胎児体重の増加の抑制が報告されている。〕

#### 5. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

#### 6. 適用上の注意

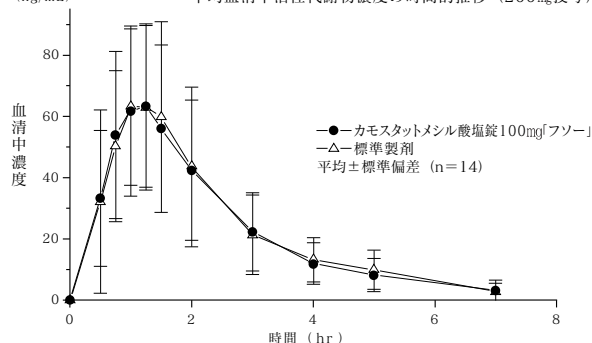
薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、さらには穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。)

### ※【薬物動態】

#### (1) 生物学的同等性試験

カモスタットメシル酸塩錠100mg「フソー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠(カモスタットメシル酸塩として200mg)を健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中活性代謝物(4-(4-グアニジノベンゾイルオキシ)フェニル酢酸)濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ( $C_{max}$ 、AUC)について分散分析にて統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

(ng/mL) 平均血清中活性代謝物濃度の時間的推移(200mg投与)



## 【主要文献及び文献請求先】

- 1) ダイト株式会社 社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) ダイト株式会社 社内資料(溶出挙動)
- ※※3) 第十七改正日本薬局方解説書, C-1271, 廣川書店
- 4) ダイト株式会社 社内資料(安定性試験)

### 【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ください。

ダイト株式会社 信頼性保証本部安全管理室  
〒101-0047 東京都千代田区内神田3-6-2  
TEL: 03-5294-7147 FAX: 03-5294-7148  
(9:00~17:30/土日祝日を除く)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	C <sub>max</sub> (ng/mL)	AUC <sub>0-7hr</sub> (ng·hr/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
カモスタットメシル酸塩錠100mg「フソー」	70.40±28.57	160.41±70.15	1.1±0.3	1.3±0.3
標準製剤(錠剤、100mg)	75.34±28.61	164.03±66.76	1.1±0.3	1.4±0.4

平均±標準偏差 (n=14)

血清中濃度並びにC<sub>max</sub>、AUC等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

### (2) 溶出挙動

カモスタットメシル酸塩錠100mg「フソー」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたメシル酸カモスタット錠の溶出規格に適合していることが確認されている。<sup>2)</sup>

### 【薬効薬理】<sup>3)</sup>

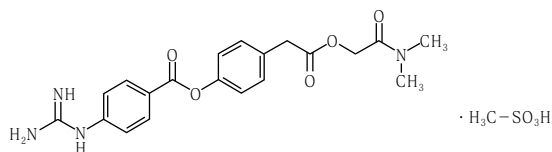
タンパク質分解酵素阻害作用を持ち、トリプシン、血漿カリクレイン、プラスミン、カリジノゲナーゼ、トロンピン、C<sub>1r</sub>、C<sub>1</sub>-エステラーゼに対し阻害作用を示す。パングレアチンと膵カリクレインに対する効果は弱く、α-キモトリプシン、ペプシン、プロメライン、セミアルカリプロテイナーゼ、セラペプターゼには作用しない。経口投与時の血中代謝産物である4-(4-グアニジノベンゾイルオキシ)フェニル酢酸にもほぼ同等の活性が認められる。実験的に膵炎を起こさせた動物に投与すると、延命効果が認められる。また、Oddi筋弛緩作用、血液凝固・線溶系に対する阻害作用も認められている。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名: カモスタットメシル酸塩 (camostat mesilate)

化学名: Dimethylcarbamoylmethyl 4-(4-guanidino-benzoyloxy)phenylacetate monomethanesulfonate

構造式:



分子式: C<sub>20</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>O<sub>5</sub> · CH<sub>4</sub>O<sub>3</sub>S

分子量: 494.52

融点: 194~198℃

性状: 白色の結晶又は結晶性の粉末である。

水にやや溶けにくく、エタノール(95)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

### ※ 【取り扱い上の注意】

#### ・安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃・60%RH、3年間)の結果、外観、溶出挙動、含量等は規格の範囲内であり、カモスタットメシル酸塩錠100mg「フソー」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。<sup>4)</sup>

### ※ 【包装】

カモスタットメシル酸塩錠100mg「フソー」 (瓶) 1,000錠  
(PTP) 100錠 (10錠×10)  
500錠 (10錠×50)  
1,000錠 (10錠×100)

販売元  
**扶桑薬品工業株式会社**  
大阪市城東区森之宮二丁目3番11号

製造販売元  
**DAITO ダイト株式会社**  
富山県富山市八日町326番地