

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会 IF 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成（一部記載要領 2013 に準拠）

蛋白分解酵素阻害剤

ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg「AFP」

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）

剤 形	凍結乾燥注射剤
製 剤 の 規 制 区 分	劇薬 処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規 格 ・ 含 量	100mg：1 バイアル中にガベキサートメシル酸塩（日局）100mg を含有する。 500mg：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。
一 般 名	和名：ガベキサートメシル酸塩（JAN） 洋名：Gabexate Mesilate（JAN）
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2015 年 2 月 12 日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2015 年 6 月 19 日（販売名変更による） 販売開始年月日：1984 年 7 月 18 日（100mg） ：1994 年 8 月 1 日（500mg）
製 造 販 売 （ 輸 入 ） ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	販 売 元：アルフレッサ ファーマ株式会社 製造販売元：共創未来ファーマ株式会社
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	
問 い 合 わ せ 窓 口	アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部 TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212 医療関係者向けホームページ https://www.alfresa-pharma.co.jp/auth/confirm/ref=/medical/

本 IF は 2016 年 11 月改訂（第 13 版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第 2 小委員会が I F の位置付け、I F 記載様式、I F 記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第 3 小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会が I F 記載要領の改訂を行ってきた。

I F 記載要領 2008 以降、I F は P D F 等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加した I F が速やかに提供されることとなった。最新版の I F は、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品の I F の情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々の I F が添付文書を補完する適正使用情報として適切に審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「I F 記載要領 2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

I F に記載する項目配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された I F は、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

I F の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I F の利用にあたって

電子媒体の I F は、PMDA の医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I F の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I F が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I Fを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。
I Fは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的特性	1
3. 製品の製剤学的特性	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1
6. RMPの概要	2
II. 名称に関する項目	3
1. 販売名	3
2. 一般名	3
3. 構造式又は示性式	3
4. 分子式及び分子量	3
5. 化学名（命名法）又は本質	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 物理化学的性質	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4
IV. 製剤に関する項目	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	5
3. 添付溶解液の組成及び容量	5
4. 力価	5
5. 混入する可能性のある夾雑物	6
6. 製剤の各種条件下における安定性	6
7. 調製法及び溶解後の安定性	6
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7
9. 溶出性	8
10. 容器・包装	8
11. 別途提供される資材類	8
12. その他	9
V. 治療に関する項目	10
1. 効能又は効果	10
2. 効能又は効果に関連する注意	10
3. 用法及び用量	10
4. 用法及び用量に関連する注意	10
5. 臨床成績	11
VI. 薬効薬理に関する項目	12
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	12
2. 薬理作用	12
VII. 薬物動態に関する項目	13
1. 血中濃度の推移	13
2. 薬物速度論的パラメータ	13
3. 母集団（ポピュレーション）解析	14
4. 吸収	14
5. 分布	14
6. 代謝	14
7. 排泄	15

8. トランスポーターに関する情報	15
9. 透析等による除去率	15
10. 特定の背景を有する患者	15
11. その他	15
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	16
1. 警告内容とその理由	16
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	16
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	16
5. 慎重投与内容とその理由	16
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16
7. 相互作用	16
8. 副作用	17
9. 高齢者への投与	18
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	18
11. 小児等への投与	18
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
13. 過量投与	18
14. 適用上の注意	18
15. その他の注意	18
16. その他	18
IX. 非臨床試験に関する項目	19
1. 薬理試験	19
2. 毒性試験	19
X. 管理的事項に関する項目	20
1. 規制区分	20
2. 有効期間	20
3. 包装状態での貯法	20
4. 取扱い上の注意	20
5. 患者向け資材	20
6. 同一成分・同効薬	20
7. 国際誕生年月日	20
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	21
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	21
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
11. 再審査期間	21
12. 投薬期間制限に関する情報	21
13. 各種コード	21
14. 保険給付上の注意	22
XI. 文献	23
1. 引用文献	23
2. その他の参考文献	23
XII. 参考資料	24
1. 主な外国での発売状況	24
2. 海外における臨床支援情報	24
XIII. 備考	25
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	25
2. その他の関連資料	26

略語表

なし（個別に各項目において解説する。）

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg「AFP」は、後発医薬品として三共ゾーキ株式会社（現：共創未来ファーマ株式会社）が開発を企画し、規格及び試験方法を設定、加速試験を行い、1984年2月に注射用パナベートの販売名で承認を取得、1984年7月に上市した。1987年5月29日に添加剤（クエン酸及び炭酸ナトリウム）追加に関する一部変更承認を取得した。1988年10月27日に汎発性血管内血液凝固症に関する効能または効果、用法及び用量の一部変更承認を取得した。1994年10月28日に添加剤（D マンニトール、クエン酸及び炭酸ナトリウム）削除に関する一部変更承認を取得した。注射用パナベートは、2007年に医療事故防止のため販売名を注射用パナベート 100に変更した。2015年2月に販売名を一般名称に変更し、現在に至っている。

ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg「AFP」は 1994年3月に注射用パナベート 500の販売名で承認を取得、1994年8月に上市した。2015年2月に販売名を一般名称に変更し、現在に至っている。

2. 製品の治療学的特性

(1) 蛋白分解酵素阻害作用（*in vitro*）

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。（「VI. 薬効薬理に関する項目 2. 薬理作用」を参照）

(2) 重大な副作用としてショック、アナフィラキシーショック、アナフィラキシー、注射部位の皮膚潰瘍・壊死、無顆粒球症、白血球減少、血小板減少、高カリウム血症（いずれも頻度不明）が報告されている。（「VIII. 安全性（使用上の注意）」に関する項目 8. 副作用」を参照）

3. 製品の製剤学的特性

該当資料なし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、 最適使用推進ガイドライン等	有無
医薬品リスク管理計画（以下 RMP）	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」

ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」

(2) 洋名

GABEXATE MESILATE FOR INJECTION

(3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格（含量）＋「AFP」

薬食審査発第 0922001 号（平成 17 年 9 月 22 日）に基づく

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ガベキサートメシル酸塩（JAN）

(2) 洋名（命名法）

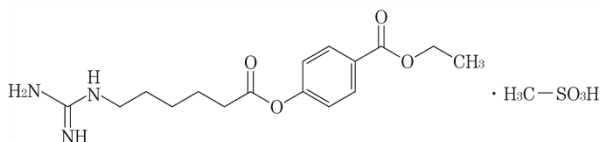
Gabexate Mesilate（JAN）、gabexate（INN）

(3) ステム（stem）

酵素阻害剤：gab

3. 構造式又は示性式

構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式： $C_{16}H_{23}N_3O_4 \cdot CH_4O_3S$

分子量：417.48

5. 化学名（命名法）又は本質

Ethyl 4-(6-guanidinohexanoyloxy)benzoate monomethanesulfonate（IUPAC）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

1) 各種溶媒における溶解度：水に極めて溶けやすく、エタノール（95）に溶けやすい。

2) 各種 pH 溶媒に対する溶解度：該当資料なし

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：90～93℃

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法：日本薬局方ガベキサートメシル酸塩による

定量法：日本薬局方ガベキサートメシル酸塩による

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

注射剤（凍結乾燥品）

(2) 製剤の外観及び性状

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。

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

100mg：本品 1 バイアルを 5 w/v%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。

500mg：本品 1 バイアルを 5 w/v%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。

(5) その他

注射剤の容器中の特殊な気体の有無：有（窒素置換）

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」	ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」
有効成分 (1 バイアル中)	ガベキサートメシル酸塩（日局）100 mg	ガベキサートメシル酸塩（日局）500 mg
添加剤	なし	なし

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

パラオキシ安息香酸エチル

グアニジノカプロン酸メタンスルホン酸塩

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」¹⁾

加速試験：

保存条件	保存形態	保存期間	結果
40℃	最終包装形態	6 ヶ月	規格内

項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、乾燥減量、重量偏差試験、不溶性異物試験、無菌試験、定量

苛酷試験：

保存条件	保存形態	保存期間	結果
25℃、散乱光下（約 600Lux）	最終包装形態	6 ヶ月（約 130 万 Lux・hr 照射時点）	規格内

項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、乾燥減量、重量偏差試験、不溶性異物試験、無菌試験、定量

(2) ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」²⁾

加速試験：

保存条件	保存形態	保存期間	結果
40℃	最終包装形態	6 ヶ月	規格内

項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、乾燥減量、重量偏差試験、不溶性異物試験、無菌試験、定量

苛酷試験：

保存条件	保存形態	保存期間	結果
25℃、散乱光下（約 600Lux）	最終包装形態	6 ヶ月（約 130 万 Lux・hr 照射時点）	規格内

項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、乾燥減量、重量偏差試験、不溶性異物試験、無菌試験、定量

7. 調製法及び溶解後の安定性

(1) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」³⁾

溶解後安定性試験（10℃）：

保存条件	溶解液	保存期間	結果
10℃	5%ブドウ糖注射液 500mL	10 日	ガベキサートメシル酸塩量：変化無し パラオキシ安息香酸エチル量：経時的増加 pH：規格内
	リンゲル液 500mL		
	注射用水 5mL		

項目：ガベキサートメシル酸塩量、パラオキシ安息香酸エチル量、pH

溶解後安定性試験（室温散乱光下）：

保存条件	溶解液	希釈液	保存期間	結果
10℃	生理食塩液 5mL	生理食塩液	72 時間	外観：変化なし pH：低下 含量：低下
	5%ブドウ糖液 5mL			
	注射用水 5mL			

項目：外観、pH、含量

(2) ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg「AFP」⁴⁾

溶解後安定性試験（室温、10℃）：

保存条件	溶解液	保存期間	結果
室温	5%ブドウ糖注射液 500mL	3 日	ガベキサートメシル酸塩量：変化無し パラオキシ安息香酸エチル量：変化無し pH：変化無し
	リンゲル液 500mL		
	生理食塩液 500mL		
10℃	5%ブドウ糖注射液 500mL		
	リンゲル液 500mL		
	生理食塩液 500mL		

項目：ガベキサートメシル酸塩量、パラオキシ安息香酸エチル量、pH

溶解後安定性試験（室温散乱光下）：

保存条件	溶解液	希釈液	保存期間	結果
10℃	生理食塩液 5mL	生理食塩液	72 時間	外観：変化なし pH：低下 含量：低下
	5%ブドウ糖液 5mL			
	注射用水 5mL			

項目：外観、pH、含量

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

(1) pH 変動試験⁵⁾

試料：ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg「AFP」（1 バイアルを注射用蒸留水 1.0mL で溶解）

ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg「AFP」（1 バイアルを注射用蒸留水 5.0mL で溶解）

試料	規格 pH 域	試料 pH (溶解液 pH)	(A)0.1NHCl (B)0.1NNaOH	最終 pH 又は 変化点 pH	移動 指数	変化所見
ガベキサート メシル酸塩注 射用 100mg 「AFP」	4.0～ 5.5	4.95 (5.78)	(A)10.0mL	1.18	3.77	変化なし (無色澄明)
			(B) 1.40mL	8.88	3.93	白濁
ガベキサート メシル酸塩注 射用 500mg 「AFP」		4.88 (5.72)	(A)10.0mL	1.29	3.59	変化なし (無色澄明)
			(B) 6.68mL	9.33	4.45	白濁

試料	変化所見	希釈試験								浸透圧 比*
		蒸留水 20mL				蒸留水 500mL				
		0	30min	1hr	3hr	0	30min	1hr	3hr	
ガベキサート メシル酸塩注 射用 100mg 「AFP」	(A)変化なし (無色澄明)									1.1～ 1.3
	(B)白濁	8.94 (－)	8.66 (－)	8.53 (－)	8.21 (－)	8.78 (－)	8.58 (－)	8.44 (－)	8.14 (－)	
ガベキサート メシル酸塩注 射用 500mg 「AFP」	(A)変化なし (無色澄明)									
	(B)白濁	9.62 (＋)	9.06 (＋)	8.83 (＋)	8.41 (＋)	9.13 (－)	8.82 (－)	8.68 (－)	8.39 (－)	

0 時間上段の数値は希釈直後の pH

(+) は外観変化が継続しているもの、(-) は外観変化が無く再び澄明になったことを示す。

* : ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」 1 バイアルを 5w/v%ブドウ糖注射液 10mL、ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」 1 バイアルを 5w/v%ブドウ糖注射液 50mL に溶解 (生理食塩液対比)

(2) 配合変化試験

「XIII. 備考 2. その他の関連資料」の項参照

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報
該当しない

(2) 包装

ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」 : 10 バイアル、30 バイアル

ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」 : 10 バイアル

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

バイアル : 無色透明のガラス

栓 : ブチルゴム

キャップ : アルミニウム、ポリプロピレン

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

フィルター通過性試験

(1) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」⁶⁾

輸液セット	溶解液	薬剤濃度	滴下速度	透過率	
				通過前	通過後
シュアプラグ輸液セット SP-PF356P02 (テルモ株式会社) フィルター：ポリスルホン メッシュ：0.2μm チューブ部分(輸液接触部分)：ポリブタジエン	5%ブドウ糖液	0.02% (50mg/250mL)	5mL/min	100%	100%
	リンゲル液	0.02% (100mg/500mL)	5mL/min	100%	100%

(2) ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」⁶⁾

輸液セット	溶解液	薬剤濃度	滴下速度	透過率	
				通過前	通過後
シュアプラグ輸液セット SP-PF356P02 (テルモ株式会社) フィルター：ポリスルホン メッシュ：0.2μm チューブ部分(輸液接触部分)：ポリブタジエン	5%ブドウ糖液	0.2% (50mg/250mL)	5mL/min	100%	100%
	リンゲル液	0.1% (100mg/500mL)	5mL/min	100%	100%

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

(1) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg「AFP」

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) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg「AFP」、ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg「AFP」

汎発性血管内血液凝固症

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

1) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg「AFP」

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500～1,500mL）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) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg「AFP」、ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg「AFP」

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20～39mg/kgの範囲内で24時間かけて静脈内に持続投与する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

【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。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

カモスタットメシル酸塩、ナファモスタットメシル酸塩、ウリナスタチン

注意：関連のある化合物の効能・効果等は最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁷⁾

蛋白分解酵素阻害作用 (*in vitro*)

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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

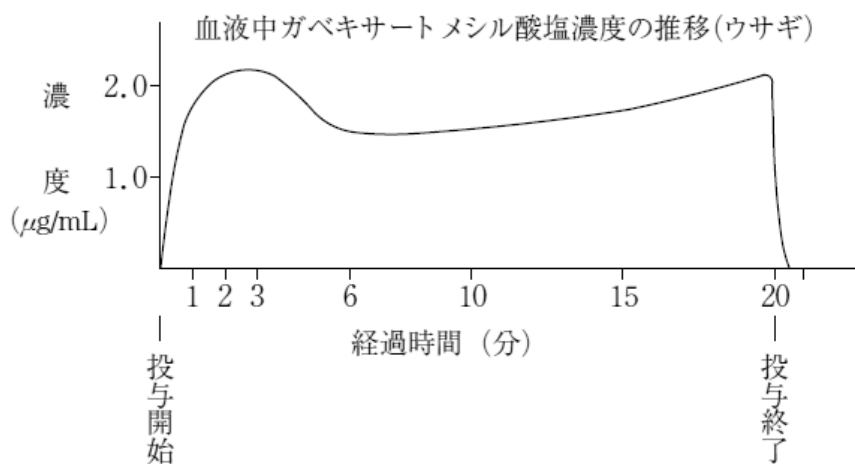
該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度⁸⁾

(参考：動物)

血中濃度

健康なウサギにガベキサートメシル酸塩として 1 mg/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。



(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

「VIII.安全性（使用上の注意等）に関する項目 7.相互作用」を参照

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積
該当資料なし

(6) その他
該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法
該当資料なし

(2) パラメータ変動要因
該当資料なし

4. 吸収 該当資料なし

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性
該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性
該当資料なし

(3) 乳汁への移行性
該当資料なし

(4) 髄液への移行性
該当資料なし

(5) その他の組織への移行性
該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率
該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路⁹⁾
血中エステラーゼによりグアニジノカプロン酸及びパラオキシ安息香酸エチルに分解される。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率
該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合
該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率
該当資料なし

7. 排泄

該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

（インタビューフォーム記載要領 2013 に準拠）

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【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. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

〔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。

5. 慎重投与内容とその理由

設定されていない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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、掻痒、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。

7. 相互作用

（1）併用禁忌とその理由

設定されていない

（2）併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

- 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。

(3) 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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) 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。
- 3) 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。

9. 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。

10. 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。〕

11. 小児等への投与

設定されていない

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

設定されていない

14. 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 1 kg 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。

15. その他の注意

設定されていない

16. その他

該当資料なし

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験
該当資料なし
- (2) 安全性薬理試験
該当資料なし
- (3) その他の薬理試験
該当資料なし

2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験
急性毒性 (LD₅₀ 値) ¹⁰⁾
尾静脈内投与 (ガベキサートメシル酸塩として : mg/kg)

マウス		ラット	
♂	♀	♂	♀
197	200	49	52

肉眼解剖所見では、臓器に異常は認められなかったが、投与部位に炎症が認められた。
本品の急性毒性は、呼吸麻痺によるものであると思われる。

- (2) 反復投与毒性試験
該当資料なし
- (3) 遺伝毒性試験
該当資料なし
- (4) がん原性試験
該当資料なし
- (5) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
- (6) 局所刺激性試験
該当資料なし
- (7) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 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こと）

有効成分：劇薬

2. 有効期間

使用期限： 3 年

3. 包装状態での貯法

100mg：遮光、室温保存

500mg：室温保存

4. 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 ヶ月）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。^{1),2)}

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無、くすりのしおり：無

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：注射用エフオーワイ

同効薬：

（膝 炎）

カモスタットメシル酸塩、ナファモスタットメシル酸塩、ウリナスタチン

（汎発性血管内血液凝固症）

ナファモスタットメシル酸塩、乾燥濃縮人アンチトロンビンⅢ、ヘパリン製剤、ダナパロイドナトリウム、トロンボモデュリンアルファ（遺伝子組換え）

7. 国際誕生年月日

1977 年 6 月 14 日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

(1) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
製造販売承認 (注射用パナベート)	1984 年 2 月 7 日	59AM 第 92 号	1984 年 6 月 2 日	1984 年 7 月 18 日
販売名変更 (注射用パナベート 100)	2007 年 3 月 22 日	21900AMX00668000	2007 年 6 月 15 日	〃
販売名変更 (ガベキサートメシル酸塩 注射用 100mg 「AFP」)	2015 年 2 月 12 日	22700AMX00264000	2015 年 6 月 19 日	〃

(2) ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
製造販売承認 (注射用パナベート 500)	1994 年 3 月 12 日	20600AMZ00364000	1994 年 7 月 8 日	1994 年 8 月 1 日
販売名変更 (ガベキサートメシル酸塩 注射用 500mg 「AFP」)	2015 年 2 月 12 日	22700AMX00265000	2015 年 6 月 19 日	〃

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

1988 年 10 月 27 日：汎発性血管内血液凝固症（ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」）

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

(1) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」

厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9 桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
3999403D1019	3999403D1302	108896014	620889614

(2) ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」

厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9 桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
3999403D2015	3999403D2112	108902803	620890203

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 共創未来ファーマ(株)：ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」 安定性試験 (社内資料)
- 2) 共創未来ファーマ(株)：ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」 安定性試験 (社内資料)
- 3) 共創未来ファーマ(株)：ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」 溶解後安定性試験 (社内資料)
- 4) 共創未来ファーマ(株)：ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg 「AFP」 溶解後安定性試験 (社内資料)
- 5) 共創未来ファーマ(株)：ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg/500mg 「AFP」
pH 変動試験及び希釈試験 (社内資料)
- 6) 共創未来ファーマ(株)：ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg 「AFP」 ・ ガベキサートメシル酸塩注射用
500mg 「AFP」 フィルター通過性試験 (社内資料)
- 7) 久保木正明他：薬理と治療 12：4933 (1984)
- 8) 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)
- 9) 第十七改正日本薬局方 解説書, C-1263～1267(2016)
- 10) 共創未来ファーマ(株)：急性毒性試験 (社内資料)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XⅢ. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

1) ガベキサートメシル酸塩注射用 100mg「AFP」 配合変化表

配合薬剤 (一般名)	配合量	室 温					
		試験項目	配合前	配合直後	3 時間	6 時間	24 時間
インデラル注射液 2mg (プロプラノロール塩酸塩)	0.1% 2mL 1 管	外観	無色澄明	同左	同左	同左	同左
		pH	3.1	3.5	3.5	3.5	3.5
ソル・コーテフ注射用 (ヒドロコルチゾンコハク酸エステルナトリウム)	100mg 1 瓶	外観	無色澄明	白濁	油状沈殿	同左	同左
		pH	7.6	7.5	—	—	—
ボスミン注 (アドレナリン)	0.1% 1mL 1 管	外観	無色澄明	同左	同左	同左	同左
		pH	2.7	3.6	3.6	3.6	3.5
ブドウ糖注射液(大塚糖液)10% (ブドウ糖)	10% 500mL 1 瓶	外観	無色澄明	同左	同左	同左	同左
		pH	4.3	4.3	4.3	4.3	4.3
低分子デキストランL注 (乳酸リンゲル液(デキストラン 40加))	250mL 1 瓶	外観	無色澄明	同左	同左	同左	同左
		pH	5.4	5.4	5.4	5.4	5.4
ポタコールR (乳酸リンゲル液(マルトース 加))	500mL 1 瓶	外観	無色澄明	同左	同左	同左	同左
		pH	4.9	4.9	4.9	4.9	4.9
ゲンタシン注 40mg※ (ゲンタマイシン硫酸塩)	40mg(力価) 1 管	外観	無色澄明	白濁	白色沈殿	同左	同左
		pH	5.2	4.6	—	—	—
パニマイシン注射液※ (ジベカシン硫酸塩)	50mg(力価) 1mL 1 管	外観	無色澄明	白濁	白色沈殿	同左	同左
		pH	6.7	—	—	—	—
パンスポリン静注用 0.5g※ (セフトリアム塩酸塩)	0.5g(力価)/ 注射用水 20mL	外観	微黄色澄明	微濁	白濁	同左	油状沈殿
		pH	6.3	6.3	—	—	—
リンコシン注射液 (リンコマイシン塩酸塩水和物)	300mg 1mL 1 瓶	外観	無色澄明	同左	同左	同左	同左
		pH	4.9	4.5	4.5	4.5	4.5

*配合薬剤名及びメーカー名については、試験実施時（1986 年 9 月）の名称で記載しています。

※添付文書【使用上の注意】5.適用上の注意(3)調整時の項参照

2) ガベキサートメシル酸塩注射用 500mg「AFP」 配合変化表

配合薬剤 (一般名)	配合量	本剤 (本数)	保存 条件	試験項目	開始時	3 時間	6 時間	24 時間	48 時間	72 時間
ビタミン静注用 (リン酸チアミンジ スルフィド・B6・B1 2配合剤)	1 瓶	2	室温	外観	微赤色澄 明	同左	同左	同左	同左	同左
				pH	4.59	4.59	4.58	4.54	4.49	4.48
				定量(%)	97.5	94.8	93.8	93.7	92.1	90.6
			冷所	外観				微赤色 澄明	同左	同左
				pH				4.58	4.56	4.59
				定量(%)				93.4	92.0	91.1
シオマリン静注用 1g※ (ラタモキセフナト リウム)	1g(力 価) 1 瓶	1	室温	外観	無色澄明	同左	同左	微黄色 澄明	淡黄色 澄明	同左
				pH	5.90	5.95	5.86	5.76	5.64	5.60
				定量(%)	100.0	98.0	95.0	93.0	92.0	88.0
			冷所	外観				微白濁 *(室温放置により澄 明)		
				pH				5.94	5.81	5.73
				定量(%)				95.0	94.0	93.0
	1g(力 価) 2 瓶	1	室温	外観	白濁	-	-	-	-	-
				pH	-	-	-	-	-	-
				定量(%)	-	-	-	-	-	-
			冷所	外観				-	-	-
				pH				-	-	-
				定量(%)				-	-	-

*配合薬剤名及びメーカー名については、試験実施時(1994年10月)の名称で記載しています。

※添付文書【使用上の注意】5.適用上の注意(3)調整時の項参照