

規 制 区 分	
処方箋医薬品(注意一医師等の処方箋により使用すること)	
貯 法	室温保存
使用期限	外箱、容器に表示

経口蛋白分解酵素阻害剤
カモスタットメシル酸塩錠100mg「ツルハラ」
 Camostat Mesilate Tablets 「TSURUHARA」

承認番号	22500AMX 01969000
薬価収載	2014年6月
販売開始	2000年6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】

組 成

カモスタットメシル酸塩錠100mg「ツルハラ」は1錠中カモスタットメシル酸塩 100mg および添加物として乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、マクロゴール 6000 を含有する。

製剤の性状

カモスタットメシル酸塩錠100mg「ツルハラ」は白色～帯黄白色のフィルムコーティング錠で、識別記号は HT3V である。

			直径: 約 6.6mm 厚さ: 約 4.3mm 質量: 約 130mg
---	---	---	---

【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 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 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。
- 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。
 - 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。

※3. **肝機能障害、黄疸**: AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -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。

※4. **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 ^{注)}	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) の上昇、ALT (GPT) の上昇等
腎 臓	BUN の上昇、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)。

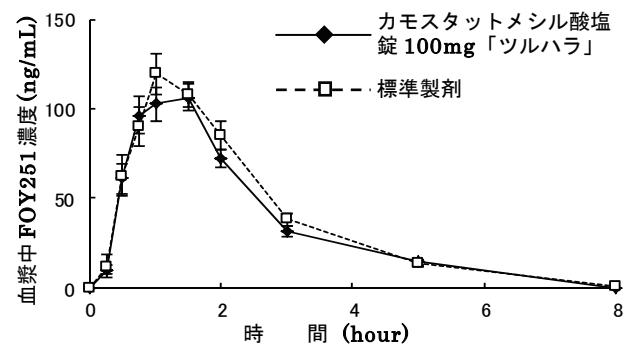
(6) 適用上の注意

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、更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¹⁾

カモスタットメシル酸塩錠100mg「ツルハラ」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 200mg)を健康成人男子に絶食時単回経口投与して活性代謝物である4-(4-グアニジノベンゾイルオキシ)フェニル酢酸(FOY251)血漿中濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₈ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
カモスタットメシル酸塩錠100mg「ツルハラ」	270.2 ± 11.3	130.9 ± 5.7	1.1 ± 0.1	1.3 ± 0.1
標準製剤(錠剤、100mg)	295.1 ± 17.1	133.8 ± 9.2	1.1 ± 0.1	1.1 ± 0.03

(Mean ± S.E., n=14)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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²⁾

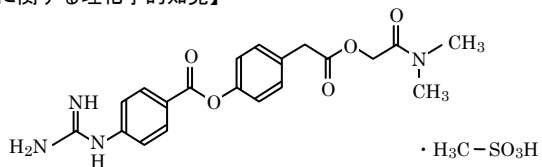
カモスタットメシル酸塩錠100mg「ツルハラ」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたカモスタットメシル酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

蛋白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、トロンビン等に対し強い阻害作用を示すが、 α -キモトリプシン、ペプシン、パンクレアチン等に対してはほとんど阻害作用を示さない。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。実験的に膝炎を起こさせた動物に投与すると、延命効果が認められ、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】

構造式：



一般名：カモスタットメシル酸塩 (Camostat Mesilate)

化学名：Dimethylcarbamoylmethyl 4-(4-guanidinobenzoyloxy)phenylacetate monomethanesulfonate

分子式：C₂₀H₂₂N₄O₅ · CH₄O₃S

分子量：494.52

融点：194～198℃

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。

本品は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。

【取扱い上の注意】

※※1) 本剤とオルメサルタン メドキシミル製剤等との一包化は避けること。[一包化して高温多湿条件下にて保管した場合、本剤が着色することがある。]

2) 安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、カモスタットメシル酸塩錠100mg「ツルハラ」は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。

【包装】

(PTP)：100錠、1000錠

【主要文献】

- 1) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 2) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 3) 鶴原製薬株式会社 社内資料

【文献請求先】

鶴原製薬株式会社 医薬情報部
〒563-0036 大阪府池田市豊島北1丁目16番1号
TEL：072-761-1456 (代表) FAX：072-760-5252



製造販売元
鶴原製薬株式会社
大阪府池田市豊島北1丁目16番1号

(C55-11 11-1803)
A803