

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018(2019年更新版)に準拠して作成

経口蛋白分解酵素阻害剤

カモスタットメシル酸塩錠

## カモスタットメシル酸塩錠 100mg「サワイ」

CAMOSTAT MESILATE Tablets [SAWAI]

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品 <sup>注)</sup> 注)注意—医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1錠中日局カモスタットメシル酸塩100mg含有
一般名	和名：カモスタットメシル酸塩(JAN) 洋名：Camostat Mesilate(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2012年1月30日(販売名変更) 薬価基準収載年月日：2012年6月22日(販売名変更) 販売開始年月日：1996年7月5日
製造販売(輸入)・提携・販売会社名	発売元：沢井製薬株式会社 製造販売元：メディサ新薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2023年5月改訂の電子添文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。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

## 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、IF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IFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIF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IF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IFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・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、IF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. IFとは

IF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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF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IF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IF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。

IF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. IFの利用にあたって

電子媒体のIF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IFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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、IF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、IF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、IF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

IF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。IF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・表現には薬機法の広告規則や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、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IF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、IF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。

(2020年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	17
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	17
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	17
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	17
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	17
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	17
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	17
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	18
1. 販売名	3	8. 副作用	18
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	19
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	19
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	19
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	IX. 非臨床試験に関する項目	20
III. 有効成分に関する項目	4	1. 薬理試験	20
1. 物理化学的性質	4	2. 毒性試験	20
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	X. 管理的事項に関する項目	21
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	1. 規制区分	21
IV. 製剤に関する項目	5	2. 有効期間	21
1. 剤形	5	3. 包装状態での貯法	21
2. 製剤の組成	5	4. 取扱い上の注意	21
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	5. 患者向け資材	21
4. 力価	6	6. 同一成分・同効薬	21
5. 混入する可能性のある夾雑物	6	7. 国際誕生年月日	21
6. 製剤の各種条件下における安定性	6	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
7. 調製法及び溶解後の安定性	6	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	22
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	22
9. 溶出性	7	11. 再審査期間	22
10. 容器・包装	7	12. 投薬期間制限に関する情報	22
11. 別途提供される資材類	8	13. 各種コード	22
12. その他	8	14. 保険給付上の注意	22
V. 治療に関する項目	9	XI. 文献	23
1. 効能又は効果	9	1. 引用文献	23
2. 効能又は効果に関連する注意	9	2. その他の参考文献	24
3. 用法及び用量	9	XII. 参考資料	25
4. 用法及び用量に関連する注意	9	1. 主な外国での発売状況	25
5. 臨床成績	9	2. 海外における臨床支援情報	25
VI. 薬効薬理に関する項目	11	XIII. 備考	26
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	11	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	26
2. 薬理作用	11	2. その他の関連資料	26
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	14		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	15		
4. 吸収	15		
5. 分布	15		
6. 代謝	15		
7. 排泄	16		
8. トランスポーターに関する情報	16		
9. 透析等による除去率	16		
10. 特定の背景を有する患者	16		
11. その他	16		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」は、日局カモスタットメシル酸塩を含有する経口蛋白分解酵素阻害剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

	メシタット錠100(旧販売名)
承認申請に際し準拠した通知名	昭和55年5月30日 薬発第698号
承認	1996年2月
上市	1996年7月

2001年3月に「術後逆流性食道炎」の効能又は効果が追加承認された。(X. -9. 参照)

2012年6月に「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づき、『カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」』に販売名を変更した。

### 2. 製品の治療学的特性

1)カモスタットメシル酸塩は経口投与ですみやかに生体のキニン生成系、線溶系、凝固系及び補体系に作用し、その酵素活性をすみやかに阻害し異常亢進を抑制することにより、慢性膵炎の炎症症状と疼痛の緩解並びにアミラーゼ値の改善に効果が認められている。また、術後食道内に逆流する消化液中のトリプシンを阻害することにより、術後逆流性食道炎の改善に効果が認められている。(VI. -2. 参照)

2)重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、血小板減少、肝機能障害、黄疸、高カリウム血症が報告されている。(VIII. -8. 参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

特になし

### 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材、最適使用ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	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

(2023年12月1日時点)

### 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

I. 概要に関する項目

- 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

カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」

## 2) 洋名

CAMOSTAT MESILATE Tablets [SAWAI]

## 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

## 2. 一般名 .....

## 1) 和名(命名法)

カモスタットメシル酸塩(JAN)

## 2) 洋名(命名法)

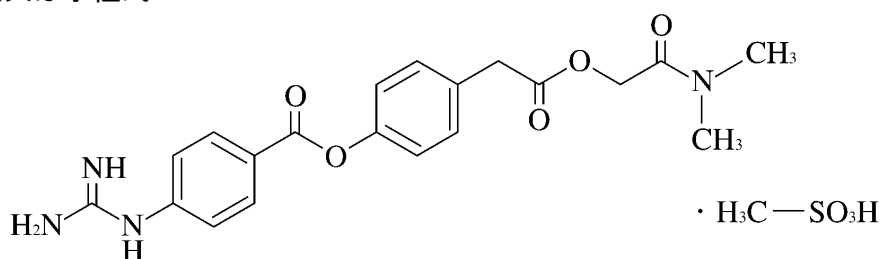
Camostat Mesilate (JAN)

Camostat (INN)

## 3) ステム(stem)

-stat:enzyme inhibitors

## 3. 構造式又は示性式 .....



## 4. 分子式及び分子量 .....

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

## 5. 化学名(命名法)又は本質 .....

Dimethylcarbamoylmethyl 4-(4-guanidinobenzoyloxy)phenylacetate  
monomethanesulfonate (IUPAC)

## 6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....

特になし

---

### 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

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。

3) 吸湿性

乾燥減量：1.0%以下(1g、シリカゲル、105℃、3時間)

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：194～198℃

5) 酸塩基解離定数

本薬はメシル酸塩で、アルカリ側で不安定なため測定していない。

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……………

液性(pH)：pH8.0以上で分解(エステル加水分解)する。

3. 有効成分の確認試験法、定量法……………

<確認試験法>

日局「カモスタットメシル酸塩」の確認試験に準ずる。

- 1) グアニジル基の呈色反応
- 2) 紫外可視吸光度測定法
- 3) メシル酸塩の確認試験

<定量法>

日局「カモスタットメシル酸塩」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)



---

## IV. 製剤に関する項目




---

## 1. 剤形

## 1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

## 2) 製剤の外観及び性状

表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
 7.1	 約131	 3.3	白色～帯黄白色

## 3) 識別コード

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW 227

## 4) 製剤の物性

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日本薬局方外医薬品規格第3部 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。  
(水、30分：80%以上)

## 5) その他

該当しない

## 2. 製剤の組成

## 1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

有効成分 [1錠中]	日局カモスタットメシル酸塩 100mg
添加剤	カルナウバロウ、カルメロースCa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース

## 2) 電解質等の濃度

該当資料なし

## 3) 熱量

該当資料なし

## 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

IV. 製剤に関する項目

4. 力価 .....  
該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物 .....  
該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性 .....

1) 長期保存試験<sup>1)</sup>

カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(ポリエチレン袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	室温・遮光 3年
性状	白色～帯黄白色のフィルムコーティング錠であった	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.5	99.6

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験<sup>2)</sup>

カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件下で硬度低下、光の条件下で性状変化が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C 75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)
性状	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	若干の退色
硬度(kg)	8.5	8.5	5.5	8.2
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.9	99.5	99.5

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

7. 調製法及び溶解後の安定性 .....  
該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的变化) .....

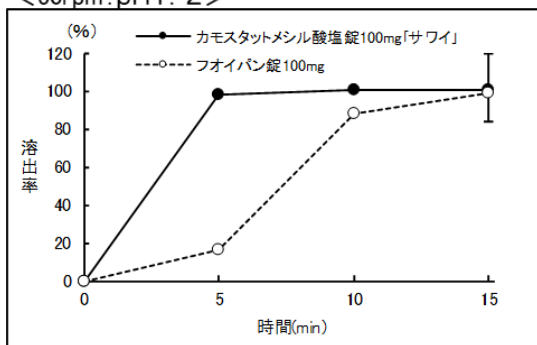
VIII. -11. 参照

## 9. 溶出性

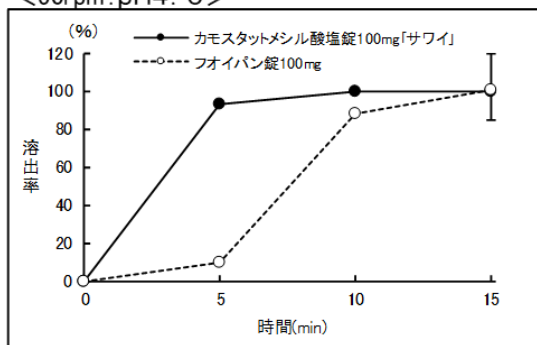
<溶出挙動における同等性及び類似性><sup>3)</sup>

品質再評価結果通知日	1999年10月7日	オレンジブック収載	No. 2
通知等	「医療用医薬品の品質再評価に係る公的溶出試験(案)等について」：平成11年3月25日 医薬審第601号		
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水)	
試験回数	6 ベッセル		
試験製剤	カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」		
標準製剤	フオイパン錠100mg		
結果及び考察	<50rpm：pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm：pH4.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm：pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm：水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。  以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。		

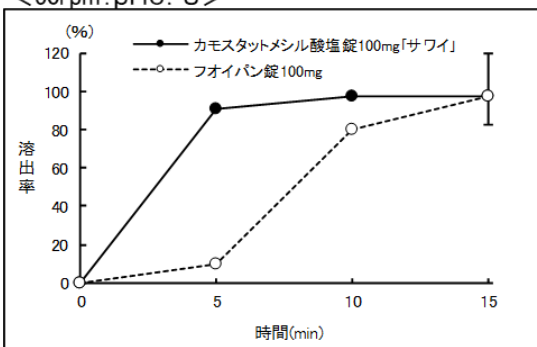
&lt;50rpm：pH1.2&gt;



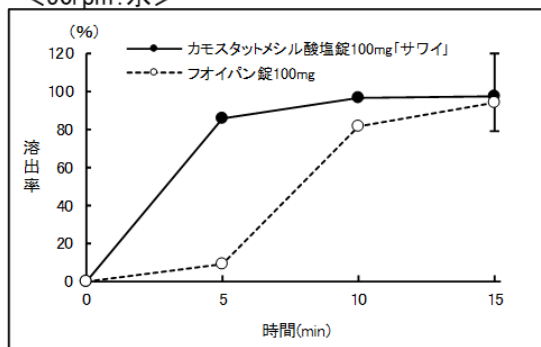
&lt;50rpm：pH4.0&gt;



&lt;50rpm：pH6.8&gt;



&lt;50rpm：水&gt;



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

## 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

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

2) 包装

22. 包装

PTP : 100錠(10錠×10)

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔  
[ピロー]ポリエチレンフィルム

11. 別途提供される資材類 .....

該当しない

12. その他 .....

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### 4. 効能又は効果

- 慢性膵炎における急性症状の緩解
- 術後逆流性食道炎

### 2. 効能又は効果に関連する注意

#### 5. 効能又は効果に関連する注意

〈慢性膵炎における急性症状の緩解〉

5.1 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。

〈術後逆流性食道炎〉

5.2 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。

### 3. 用法及び用量

#### 1) 用法及び用量の解説

#### 6. 用法及び用量

〈慢性膵炎における急性症状の緩解〉

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〉

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。

#### 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

設定されていない

### 5. 臨床成績

#### 1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### 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

## V. 治療に関する項目

### 4) 検証的試験

#### (1) 有効性検証試験

##### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

##### <慢性膵炎における急性症状の緩解>

##### 17.1.1 国内二重盲検比較試験

慢性膵炎を対象に二重盲検比較試験を行い、慢性膵炎の主症状である圧痛、尿アミラーゼ値、悪心・嘔吐、鼓腸の改善度において、対照群と比較して有意の差が認められ、有用性が報告されている<sup>4)</sup>。

##### 17.1.2 国内臨床試験

慢性膵炎を対象とした二重盲検比較試験を含む臨床試験において、疼痛、圧痛、血清アミラーゼ値、尿アミラーゼ値等の症状の改善が認められ、その有効率は48.9% (155/317例) である<sup>4~15)</sup>。

##### <術後逆流性食道炎>

##### 17.1.3 国内臨床試験

術後逆流性食道炎を対象とした二重盲検比較試験を含む臨床試験において、内視鏡によりびらん、出血等の改善が認められ、かつ、胸やけ、胸部疼痛、胸部熱感等の自覚症状改善が認められ、その有効率は82.0% (132/161例) である<sup>16~20)</sup>。

#### (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

該当しない

### 7) その他

該当資料なし

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

非ペプチド蛋白分解酵素阻害作用：カモスタットメシル酸塩以外の化合物はない<sup>21)</sup>

### 2. 薬理作用

#### 1) 作用部位・作用機序

##### 18.1 作用機序

カモスタットメシル酸塩は経口投与ですみやかに生体のキニン生成系、線溶系、凝固系及び補体系に作用し、その酵素活性をすみやかに阻害し異常亢進を抑制することにより、慢性膵炎の炎症症状と疼痛の緩解並びにアミラーゼ値の改善に効果が認められている。また、術後食道内に逆流する消化液中のトリプシンを阻害することにより、術後逆流性食道炎の改善に効果が認められている。

#### 2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 薬理作用

##### 18.2.1 蛋白分解酵素阻害作用

(1) トリプシン、血漿カリクレイン、プラスミン、トロンビン、 $C_{1r}$ 、 $C_1$ エステラーゼに対して強い阻害作用を示す(*in vitro*)<sup>22)</sup>。一方、パンクレアチン、膵臓カリクレインに対する阻害作用は弱く、 $\alpha$ -キモトリプシン、ペプシン、ブロメライン、セミアルカリプロテアーゼ、セラチオペプチダーゼに対しては阻害作用を示さない(*in vitro*)<sup>23)</sup>。

また、経口投与時の血中活性代謝物4-(4-グアニジノベンゾイルオキシ)フェニル酢酸も、ほぼカモスタットメシル酸塩に匹敵する阻害活性を有する(*in vitro*)<sup>24)</sup>。

(2) ラットに50~500mg/kgを経口投与すると、用量依存性に血中の抗トリプシン、抗プラスミン活性のすみやかな上昇が認められる<sup>25)</sup>。

また、健康成人に200、600mgを経口投与すると、用量依存性に血中抗カリクレイン活性の上昇が認められる<sup>26)</sup>。

##### 18.2.2 キニン生成系に対する阻害作用

46℃の温水中に浸したラット後肢の灌流実験において25、100mg/kgを経口投与すると、キニン様物質の遊離をそれぞれ32~41%、70~87%抑制する<sup>27)</sup>。

##### 18.2.3 凝固・線溶系に対する阻害作用

線溶亢進状態にあるウサギに50~200mg/kgを経口投与すると、Clot lysis、FDP上昇及びトロンビン時間の延長を用量依存性に抑制し、出血を減少させる<sup>28)</sup>。

##### 18.2.4 実験膵炎に対する作用

(1) 逆行性に胆汁酸とトリプシンを膵管内に注入して作成した実験膵炎ラットに25~100mg/kgを経口投与すると、用量依存性に死亡率を低下させる<sup>29)</sup>。

(2) 十二指腸閉塞ループにより作成した実験膵炎ラット(5mg/kg)及びイヌ(10mg/kg)に十二指腸内投与すると、膵浮腫像の出現を抑制するとともに、血中蛋白分解酵素活性の上昇を抑制し、死亡率を低下させる<sup>30)</sup>。

(3) コリン欠乏食で飼育したマウスにエチオニンの投与により作成したエチオニン膵炎に20~300mg/kgを1日2回経口投与すると、膵臓内の蛋白分解酵素活性の上昇を抑制し、死亡率を低下させる<sup>31)</sup>。

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 18.2.5 術後逆流性食道炎モデルに対する作用

- (1) ラット術後逆流性食道炎モデルにおいて、100mg/kgを1日2回術後2日目から5日間経口投与すると、食道粘膜潰瘍形成を抑制する<sup>32)</sup>。
- (2) イヌ術後逆流性食道炎モデルにおいて、50mgを1日3回術後14日目から14日間経口投与すると、食道のびらん及び出血等の内視鏡的所見を改善し、治療的効果を認める<sup>33)</sup>。
- (3) ラット術後逆流性食道炎モデルにおいて、100mg/kgを経口投与すると、モデルより採取した消化液中のトリプシン活性を81.8%抑制する<sup>32)</sup>。

### 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

## 16.1.1 単回投与

健康成人5例に200mgを空腹時に単回経口投与すると、活性代謝物である4-(4-グアニジノベンゾイルオキシ)フェニル酢酸の血漿中濃度は投与後40分で最高に達し、その濃度は84ng/mLで、血漿中半減期は約73分である<sup>26)</sup>。

<生物学的同等性試験><sup>34)</sup>

通知等	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱等について」：昭和55年5月30日 薬審第718号
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、3、5、7 hr
休薬期間	9日間
測定方法	高速液体クロマトグラフィー
試験製剤	カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」
標準製剤	フオイパン錠100mg

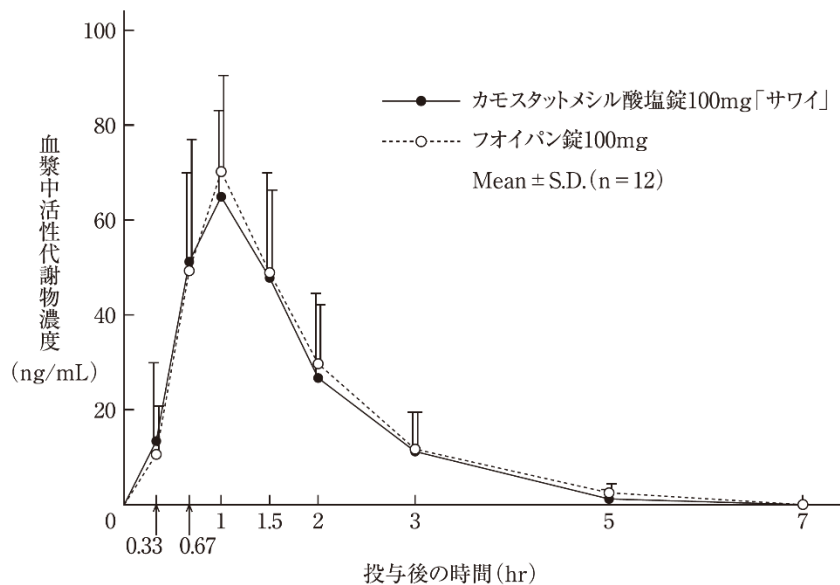
カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」とフオイパン錠100mgを健康成人男子にそれぞれ2錠(カモスタットメシル酸塩として200mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、活性代謝物である4-(4-グアニジノベンゾイルオキシ)フェニル酢酸の血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

## 各製剤2錠投与時の薬物動態パラメータ

	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-7hr</sub> (ng・hr/mL)
カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」	70.9±20.5	1.0±0.2	0.7±0.2	111.8±38.8
フオイパン錠100mg	70.2±20.3	1.0±0.0	0.9±0.4	118.5±36.1

(Mean±S.D.)

## VII. 薬物動態に関する項目



血漿中濃度ならびにAUCt、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。

### 3) 中毒域

該当資料なし

### 4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

## 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

VIII. -6. -5) 参照

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

16.3 分布

活性代謝物 4-(4-グアニジノベンゾイルオキシ)フェニル酢酸と、これが更に代謝を受けた*p*-グアニジノ安息香酸は、共に血漿中では約20%がタンパク結合している<sup>24)</sup>。

6. 代謝 .....

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

カモスタットメシル酸塩は、先ずカルボン酸エステルが加水分解されて活性代謝物 4-(4-グアニジノベンゾイルオキシ)フェニル酢酸になり、更に4-グアニジノ安息香酸にまで加水分解される<sup>35)</sup>。

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

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

Ⅶ. -6. -1) 参照

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人 5 例に 600mg<sup>注)</sup> を空腹時に単回経口投与すると、尿中代謝物はほとんどが 4-グアニジノ安息香酸であり、少量の 4-(4-グアニジノベンゾイルオキシ)フェニル酢酸が認められた。投与後 5～6 時間でほとんど排泄され、投与後 24 時間での尿中への排泄率はそれぞれ 20%、0.8%であった<sup>26)</sup>。

注) 本剤の通常 1 回用量は 100mg 又は 200mg である。

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

---

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……………

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. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………  
V. -2. 参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………  
設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由……………

8. 重要な基本的注意  
〈効能共通〉  
8.1 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こと。  
[11.1.4参照]  
〈術後逆流性食道炎〉  
8.2 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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意……………

1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者  
9.1.1 過敏症を有する患者  
副作用が発現しやすくなる。

2) 腎機能障害患者

設定されていない

3) 肝機能障害患者

設定されていない

4) 生殖能を有する者

設定されていない

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

5) 妊婦

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<sup>36)</sup>。

6) 授乳婦

設定されていない

7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

8) 高齢者

設定されていない

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

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。

1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

血圧低下、呼吸困難、そう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。

11.1.2 血小板減少(頻度不明)

11.1.3 肝機能障害、黄疸(いずれも頻度不明)

AST、ALT、 $\gamma$ -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。

11.1.4 高カリウム血症(頻度不明)

重篤な高カリウム血症があらわれることがある。[8.1参照]

2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	0.1~0.5%未満	0.1%未満	頻度不明
血液		白血球減少、赤血球減少	好酸球増多
過敏症 <small>注2)</small>	発疹、そう痒等		
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・ALT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1)：発現頻度は使用成績調査を含む。  
 注2)：発現した場合には投与を中止すること。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....  
 設定されていない

10. 過量投与 .....  
 設定されていない

11. 適用上の注意 .....

<p><b>14. 適用上の注意</b></p> <p><b>14.1 薬剤調製時の注意</b>                  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存した場合、本剤が変色することがある。</p> <p><b>14.2 薬剤交付時の注意</b>                  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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。</p>
--

12. その他の注意 .....

1) 臨床使用に基づく情報  
 設定されていない

2) 非臨床試験に基づく情報  
 設定されていない

---

## IX. 非臨床試験に関する項目

---

1. 薬理試験 .....
- 1) 薬効薬理試験  
「VI. 薬効薬理に関する項目」参照
  - 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  
該当資料なし
  - 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  
VIII. -6. -5) 参照
  - 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 .....

	規制区分
製剤	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	該当しない

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間 .....

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法 .....

室温保存

4. 取扱い上の注意 .....

VIII. -11. 参照

5. 患者向け資材 .....

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬 .....

同一成分：フオイパン錠100mg

同効薬：非ペプチド蛋白分解酵素阻害作用

カモスタットメシル酸塩以外の化合物はない<sup>21)</sup>

7. 国際誕生年月日 .....

該当しない

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 .....

カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2012年1月30日(販売名変更)、承認番号：22400AMX00078000

薬価基準収載年月日：2012年6月22日(販売名変更)

販売開始年月日：2012年6月22日(販売名変更)

メシタット錠100(旧販売名)

製造販売承認年月日：1996年2月26日、承認番号：(08AM)0149

薬価基準収載年月日：1996年7月5日

販売開始年月日：1996年7月5日

X. 管理的事項に関する項目

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

メシタット錠100(旧販売名)

承認年月日：2001年3月6日

効能又は効果内容：「術後逆流性食道炎」の効能又は効果を追加した。

用法及び用量内容：効能又は効果追加に伴い、関連の用法及び用量を追加した。

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

製品名	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番号	レセプト電算処理 システム用コード
カモスタットメシル酸塩 錠100mg「サワイ」	3999003F1319	3999003 F 1319	108822906	620882206

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

---

## XI . 文 献

---

1. 引用文献
- 1) 沢井製薬(株) 社内資料[長期保存試験] カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」
  - 2) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」
  - 3) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」
  - 4) 石井兼央他：現代医療，1984；16：844-854
  - 5) 平山亮夫他：現代医療，1980；12(臨)：253-260
  - 6) 石井兼央他：現代医療，1980；12(臨)：261-278
  - 7) 平山亮夫他：現代医療，1980；12(臨)：245-252
  - 8) 早川哲夫他：現代医療，1980；12(臨)：239-244
  - 9) 堀口祐爾他：現代医療，1980；12(臨)：227-231
  - 10) 久保田義弘他：現代医療，1980；12(臨)：211-214
  - 11) 藤原淳他：現代医療，1980；12(1)：104-107
  - 12) 安部宋頭他：現代医療，1980；12(臨)：233-238
  - 13) 田中紀男他：現代医療，1980；12(臨)：223-226
  - 14) 広野禎介：現代医療，1980；12(臨)：215-218
  - 15) 木南義男他：現代医療，1980；12(1)：108-114
  - 16) 佐藤寿雄他：臨床医薬，1992；8(8)：1877-1891
  - 17) 佐藤寿雄他：臨床医薬，1992；8(8)：1893-1908
  - 18) 杉山貢他：現代医療，1993；25(増Ⅱ)：1835-1843
  - 19) 神津照雄他：現代医療，1992；24(増Ⅳ)：3567-3574
  - 20) 渡辺正敏他：現代医療，1992；24(増Ⅳ)：3575-3582
  - 21) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>  
(2023/12/1 アクセス)
  - 22) Tamura, Y. et al. : Biochim. Biophys. Acta., 1977 ; 484 : 417-422
  - 23) 加山直宏他：現代医療，1980；12(臨)：1-10
  - 24) 日本薬局方解説書編集委員会編，第十八改正 日本薬局方解説書，廣川書店，2021，C-1355-C-1359.
  - 25) 加山直宏他：現代医療，1980；12(臨)：11-18
  - 26) 平工誠治他：医薬品研究，1982；13：756-765
  - 27) 小島隆明他：現代医療，1980；12(臨)：19-25
  - 28) 小島隆明他：現代医療，1980；12(臨)：27-33
  - 29) 桶川忠夫他：現代医療，1980；12(臨)：35-40
  - 30) Takasugi, S. et al. : Digestion, 1982 ; 24 : 36-41
  - 31) 桶川忠夫他：現代医療，1980；12(臨)：41-49
  - 32) 川淵和一十他：薬理と治療，1992；20：3517-3525
  - 33) 渡辺正敏他：現代医療，1994；26(増Ⅲ)：2983-2988
  - 34) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同源性試験] カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」
  - 35) 大木史郎他：現代医療，1980；12(臨)：71-82
  - 36) 市川祐三他：現代医療，1980；12(臨)：127-152
  - 37) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」

X I. 文献

38) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」

2. その他の参考文献 .....

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....
  
  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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### 1) 粉碎

##### <粉碎後の安定性試験><sup>37)</sup>

カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」を粉碎後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験*	100.0	98.8	98.7	99.3

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

#### 2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

##### <崩壊・懸濁性及びチューブ通過性試験><sup>38)</sup>

##### 試験方法

- カモスタットメシル酸塩錠100mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して数回転倒混和し、10分間放置した。
- 10分後シリンジを再度数回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。
- シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

##### 結果

懸濁状態	錠剤は崩壊し、懸濁液となった
チューブ通過性	通過した

### 2. その他の関連資料

#### 患者向け資料

- ・最近、こんな症状が・・・逆流性食道炎

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照



