

# 注射用エフオーワイの 安全性情報について

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

蛋白分解酵素阻害剤

注射用**エフオーワイ**<sup>®</sup> 100

注射用**エフオーワイ**<sup>®</sup> 500

〔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

〈用法・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。

**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、瘙痒、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。

●その他の「使用上の注意」等は裏面D.I.をご参照ください。

2019年4月

製造販売

 丸石製薬株式会社

## はじめに

注射用エフオーワイ（以下、本剤）は、小野薬品工業株式会社が開発した非ペプチド性蛋白分解酵素阻害剤で、「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）」及び「汎発性血管内血液凝固症」（以下、DIC）の効能・効果を有し、広くご使用いただいております。

本剤の安全性に関しては、添付文書の「重大な副作用」の項に「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」及び「高カリウム血症」を記載し、注意喚起を行っております。特に、「ショック、アナフィラキシーショック、アナフィラキシー」及び「注射部位の皮膚潰瘍・壊死」については、添付文書の改訂以外にも、安全性情報を提供するなど、注意喚起を行って参りました。しかし、現在もこれらの副作用報告が続いていることから、今回、本剤による「ショック、アナフィラキシーショック、アナフィラキシー」及び「注射部位の皮膚潰瘍・壊死」について、これまでに収集した副作用情報の分析結果をご紹介させていただきたく、本資料を作成いたしました。

本資料が本剤による副作用の病態のご理解、早期発見・早期治療に役立ち、副作用の予防・軽減の一助となれば幸いに存じます。

### 本資料を作成するにあたって

- 本資料は、発売日（1978年3月10日）より2011年12月末までに、副作用自発報告、文献・学会情報等から収集した副作用情報を対象として分析を行っています。
- 医療関係者の皆様方から「ショック、アナフィラキシーショック、アナフィラキシー」または「注射部位の皮膚潰瘍・壊死」とは異なる副作用名で報告された症例についても、企業が独自にこれらの副作用に該当すると判断したものは分析対象に含めています。
- 分析項目に関する情報が不足している症例もあり、分析から除外している場合があります。
- 自発報告を対象として分析したため、分析結果には様々なバイアスが含まれていること、副作用の正確な改善率は算出できていないことをご理解ください。

- 「副作用」に関しては裏面D.I.をご参照ください。
- 本冊子に関するお問い合わせは弊社学術情報部までお願い致します。

丸石製薬株式会社 学術情報部

〒538-0042 大阪市鶴見区今津中2-4-2

電話 0120-014-561

## 目 次

安全性情報（ご使用にあたってのお願い）	3
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	4
1-1) 添付文書の記載状況	4
1-2) 分析結果	5
(1) 本剤の使用理由	5
(2) 初発症状の発現時間	5
(3) 初発症状の種類（重複あり）	5
(4) 処置及び転帰	6
(5) 本剤投与歴（何クール目での発現か）	6
2. 注射部位の皮膚潰瘍・壊死	7
2-1) 添付文書の記載状況	7
2-2) 分析結果	8
(1) 本剤の使用理由	8
(2) 投与濃度と重症度	8
(3) 投与部位と重症度	9
(4) 液漏れと重症度	9
(5) 重症度別の対処法（静脈炎、硬結の対処方法については重複あり）	10
2-3) 注射部位の障害の治療方法	11
2-4) 中心静脈から投与した場合の血栓性静脈炎等症例	13
2-5) 非臨床試験のデータ	14

## 安全性情報 (ご使用にあたってのお願い)

### ショック症状を予防・軽減するために

- ⚠ 本剤の成分に対し**過敏症 (発赤、発疹、嘔気、気分不良等) の既往歴**のある患者さんには、投与しないでください。
- ⚠ **本剤投与開始後少なくとも10分間**は患者さんの状態を十分に観察してください。
- ⚠ 膵炎の患者さんに使用される場合 (特に本剤の投与歴がある場合) には、ご注意ください (多くのショック症例は膵炎の患者さんに使用された症例です)。

### 注射部位の皮膚潰瘍・壊死を予防・軽減するために

- ⚠ 本剤を末梢血管から投与する場合、薬液の濃度を**0.2%以下 (本剤100mgあたり50mL以上の輸液)**で使用してください (0.2%を超えると、注射部位障害の重症例の割合が増加しています)。
- ⚠ 本剤を中心静脈から投与する場合でも、可能な限り末梢血管からの投与と同様に低濃度で使用してください (本剤を中心静脈から投与して投与部位に血栓性静脈炎が発現したとの報告があります)。
- ⚠ 薬液が血管外へ漏れると、投与部位に潰瘍・壊死を起こすことがあるので、漏出しないように注意してください。また、血液うっ滞が起こらないようできるだけ太い血管から投与してください。
- ⚠ 本剤の使用に際しては、投与部位及び刺入した血管の観察を十分に行い、投与部位に血管痛、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、適切な処置を行ってください。

### 起こったときの処置は？

#### ショック、アナフィラキシーショック、アナフィラキシー

- 異常が認められた場合は直ちに本剤の投与を中止し、点滴ルート及び気道の確保、昇圧剤の投与、ステロイドの投与等、一般的なショックに対する処置を行ってください。

#### 注射部位の皮膚潰瘍・壊死

- 本剤に特有の治療方法は確立されていません。また、中和剤もありません。
- 静脈炎、硬結の場合には冷却だけではなくステロイドの局所療法 (軟膏塗布、局注) の併用もご検討ください。痛みの持続や感染を伴う遷延する硬結の場合、皮膚潰瘍や組織の壊死等が生じた場合には、外科的治療 (早期のデブリードマン、ポケットの切開、植皮等) が必要で、皮膚科、形成外科へのご紹介もご検討ください。

# 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

## 1-1) 添付文書の記載状況

〔使用上の注意〕 ー抜粋ー

### 1. 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。

### 2. 副作用

#### (1) 重大な副作用

##### 1) ショック、アナフィラキシーショック

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（いずれも頻度不明<sup>\*</sup>）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

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（頻度不明<sup>\*</sup>）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。

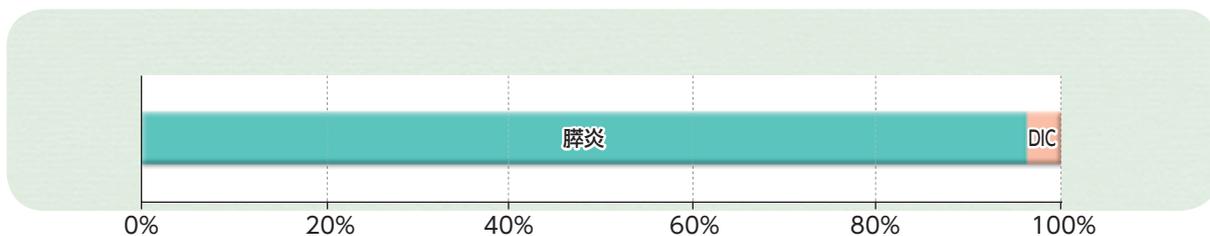
※：頻度不明は自発報告による。

## 1-2) 分析結果

● ショック、アナフィラキシーショック、アナフィラキシーと判断した193例を対象として分析しました。

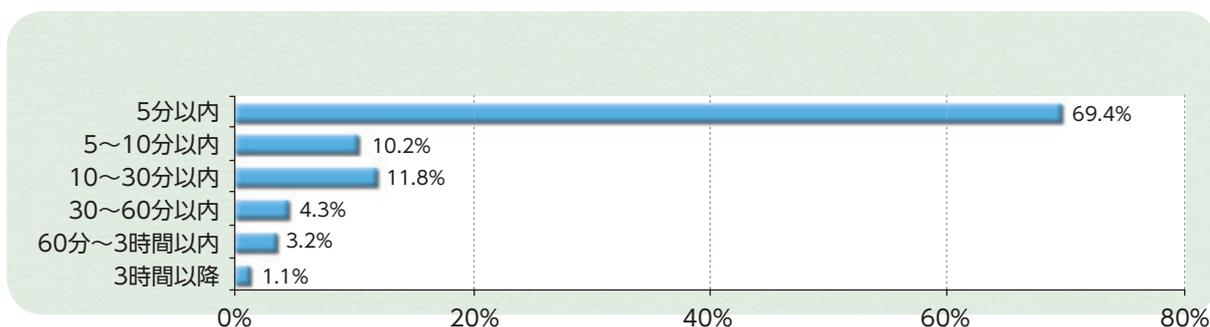
### (1) 本剤の使用理由

● 多くは膵炎に使用された症例です (193例中膵炎に使用された症例は186例、全体の96.4%)。



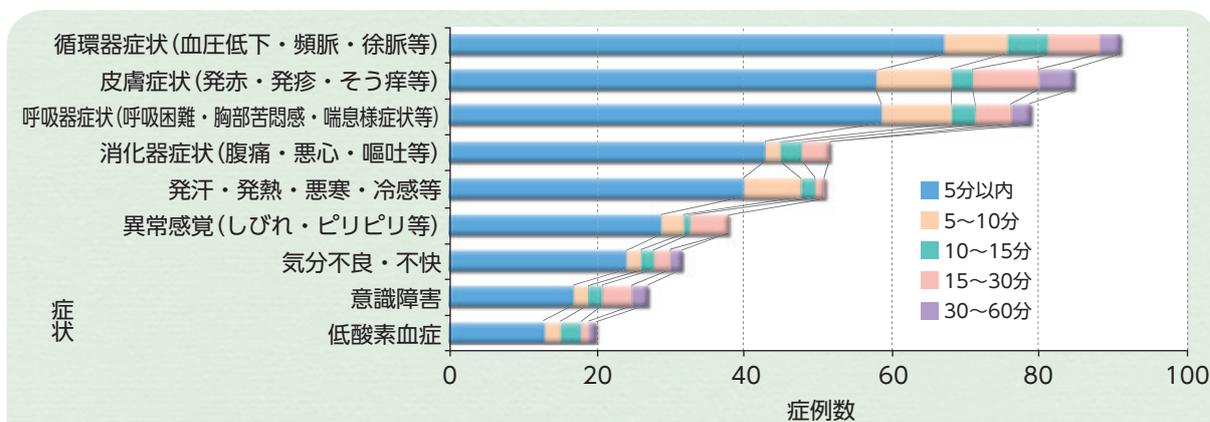
### (2) 初発症状の発現時間

● 初発症状は投与開始直後、概ね10分以内に発現しています (186例中10分以内に初発症状が認められた症例は148例、全体の79.6%)。



### (3) 初発症状の種類 (重複あり)

● 初発症状として、循環器症状 (血圧低下、頻脈、徐脈等)、皮膚症状 (発赤、発疹、そう痒等)、呼吸器症状 (呼吸困難、胸部苦悶感、喘息様症状等) が多くみられています。



〈20例未満であった初発症状〉

眼症状 (結膜充血・発赤) 11例、チアノーゼ10例、浮腫・腫脹7例、呼吸不全・停止6例、心停止・心肺停止5例、尿失禁3例、痙攣・硬直2例、鼻症状2例、全身痛2例、好酸球上昇1例

症例数：178例 (60分以内に初発症状が認められた症例)

#### (4) 処置及び転帰

- 本剤中止後に、一般的なショックに対する処置が行われています。

本剤の処置	治療	回復	軽快	後遺症	未回復	死亡	計
中止 n=191	ステロイド	47	1				48
	強心薬+ステロイド+酸素 <sup>※1</sup>	33	6				39
	ステロイド+酸素 <sup>※1</sup>	26	2				28
	強心薬+ステロイド	24	1				25
	心臓マッサージ等蘇生処置	4	2	1 <sup>※2</sup>	1	6	14
	なし	11	1				12
	強心薬+酸素 <sup>※1</sup>	7	1				8
	酸素 <sup>※1</sup>	8					8
	強心薬	2					2
	その他	3					3
	不明	3	1				4
終了後発現 n=1	強心薬	1 <sup>※3</sup>					1
不明 n=1	強心薬+ステロイド	1					1
計		170	15	1	1	6	193

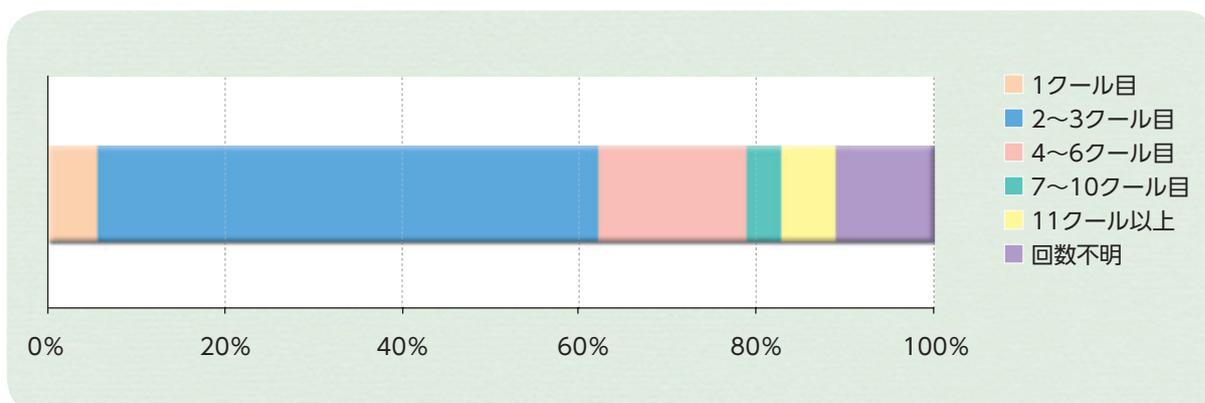
※1 酸素：酸素投与または人工呼吸管理

※2 中止21日後に声門浮腫が残っていた症例

※3 本剤投与終了直後に発現した症例

#### (5) 本剤投与歴 (何クール目での発現か)<sup>※</sup>

- 過去に本剤の投与歴のある症例が多く、11クール以上投与した後に発現した症例もみられました (166例中本剤の投与歴のある症例は157例、全体の94.6%)。



※ 報告された投与歴 (報告者が把握している投与歴) であるため、投与歴の実態は、今回の分析結果より多い可能性があります。

## 2. 注射部位の皮膚潰瘍・壊死

### 2-1) 添付文書の記載状況

#### 〔用法・用量〕

##### 1. 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. 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。

#### 〈用法・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。

#### 〔使用上の注意〕 一抜粋一

### 2. 副作用

#### (1) 重大な副作用

##### 3) 注射部位の皮膚潰瘍・壊死

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（頻度不明<sup>※</sup>）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。

※：頻度不明は自発報告による。

### 5. 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1kg当たり毎時2.5mg以下とすることが望ましい。

(2) **投与時**：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。

## 2-2) 分析結果

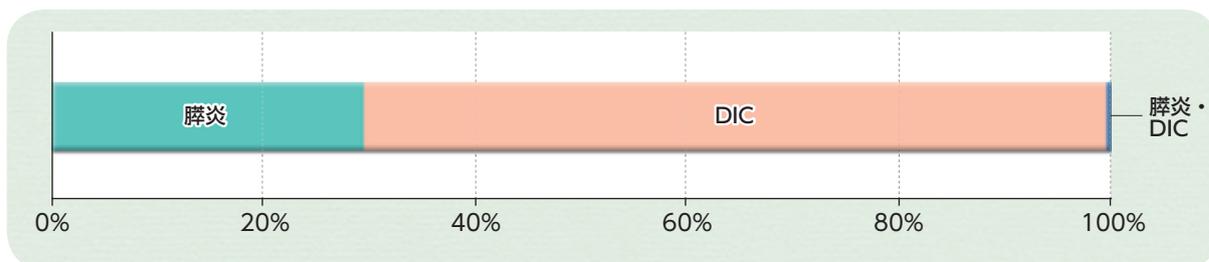
- 末梢から投与された場合の注射部位障害と判断した415例を対象として分析しました。
- 注射部位障害の最終ステージにより、3段階に分類しました。



最終ステージ	内 容	例 数
静脈炎	発赤、疼痛、腫脹等で留まった症例	140
硬 結	注射部位及び血管の硬結で留まった症例	78
潰 瘍	潰瘍または壊死に至った症例	197

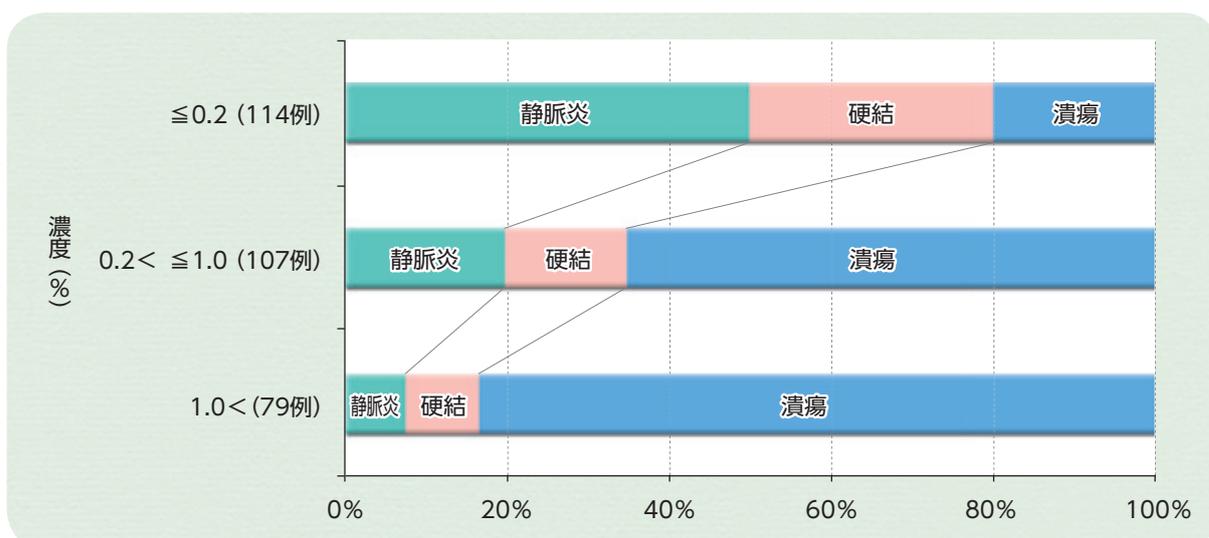
### (1) 本剤の使用理由

- 7割がDICに使用された症例です（413例中DICに使用された症例は292例、全体の70.7%）。



### (2) 投与濃度と重症度

- 投与濃度に応じて注射部位障害の重症例の割合が増加しています。



(3) 投与部位と重症度

● 下肢から投与した症例では、上肢から投与した症例に比べて重症例が多くみられています。

上肢

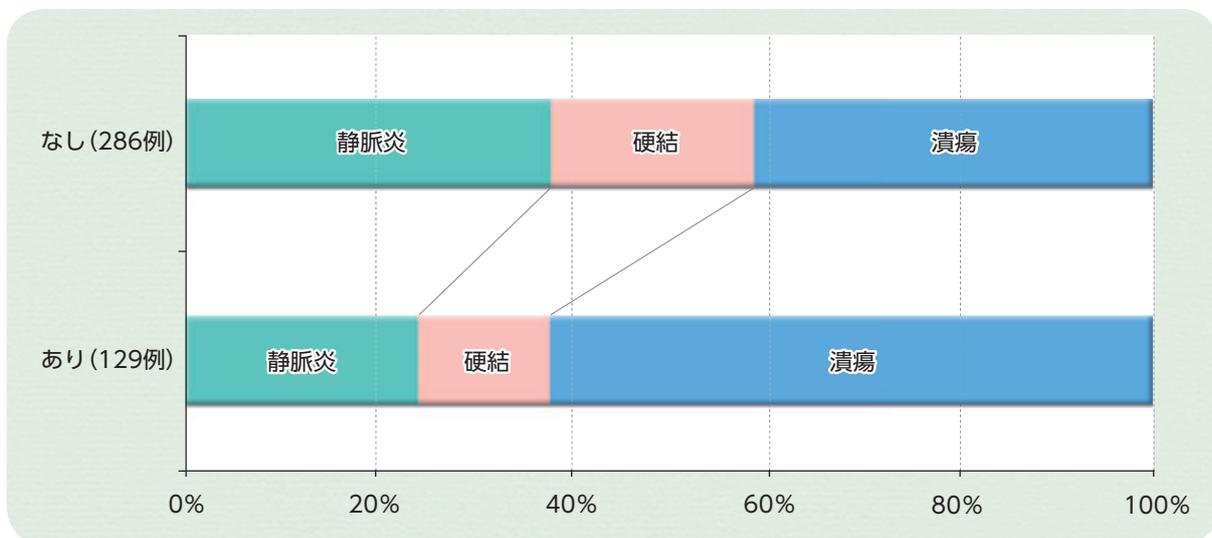
		例数	静脈炎	硬結	潰瘍
投与部位	上腕	22	7	8	7
	前腕	103	23	29	51
	手背	34	9	4	21
	肘窩	10	1	2	7
	不明	50	31	13	6
合計(投与部位)		219	71	56	92
%		100	32.4	25.6	42.0
濃度	≤0.2%	75	41	27	7
	0.2%<	101	11	17	73

下肢

		例数	静脈炎	硬結	潰瘍
投与部位	下腿	42	2	2	38
	足背	21	0	0	21
	踝	4	1	0	3
	不明	25	3	1	21
	合計(投与部位)	92	6	3	83
%		100	6.5	3.3	90.2
濃度	≤0.2%	13	0	0	13
	0.2%<	57	2	2	53

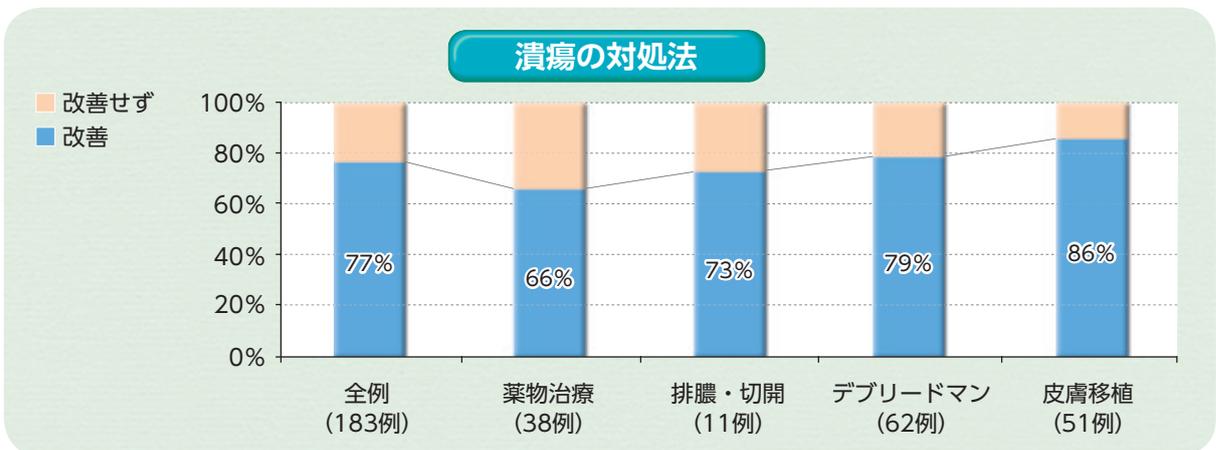
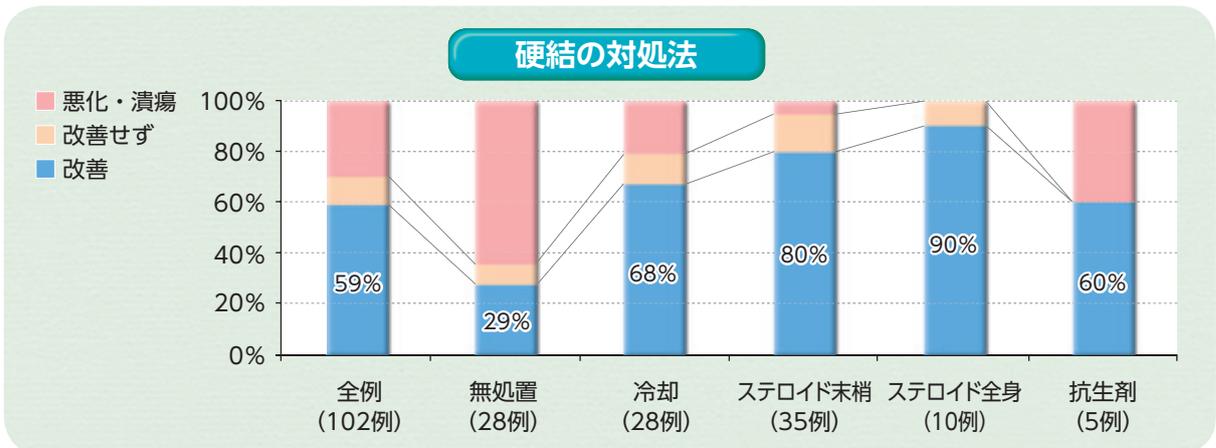
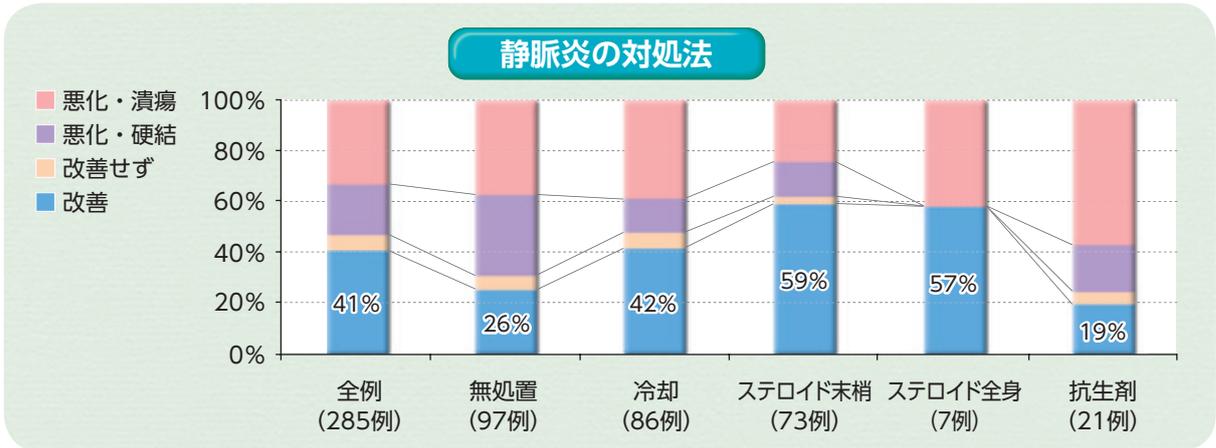
(4) 液漏れと重症度

● 液漏れありと報告された症例に重症例が多くみられています。



(5) 重症度別の対処法 (静脈炎、硬結の対処方法については重複あり)

●潰瘍に至った場合は、全体の2/3に外科的処置 (切開、デブリードマン、皮膚移植) が行われています。



## 2-3) 注射部位の障害の治療方法

本剤特有の治療方法は確立されていない。また、中和剤はない。

### ■血管外漏出が明らかな場合

1. 注射針、カテーテルをそのままにして注入を中止する（あわてて抜針をしないこと）。
2. 漏出した薬剤の拡散を防止する目的で血液3～5mL吸引した後、抜針する。  
（症例によっては、漏出部位の数カ所に穿刺、生理食塩水5～10mLを局注して薬剤を希釈することもある。なお、これらの手技は疼痛等の侵襲を伴う。）
3. 患部を冷却する（氷冷等）。
4. 注射用ステロイド（持続性と抗炎症効果からベタメタゾンリン酸エステルナトリウムが良い）を1%メピバカイン塩酸塩又は1%リドカイン塩酸塩と混和し、5～10mLに調整した溶液を漏出部位よりも広い範囲から中心部に向けて局注する。  
炎症所見が残存する場合、5～6日後同様の処置を行う。  
（例）① ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム（4mg/1mL）＋1%メピバカイン塩酸塩（4～9mL）  
② トリアムシノロンアセトニド（40mg/1mL）＋1%メピバカイン塩酸塩（4～9mL）
5. ステロイド軟膏を塗布する。

### ■静脈炎の場合

1. 患部を冷却する（氷冷等）。
2. ステロイド軟膏を塗布する。
3. 時にステロイドを発赤した静脈の周囲に局注する（注射用ステロイドは左記4.を参照）。

### ■硬結の場合

静脈炎の場合と同様に、ステロイドの局所療法（軟膏塗布、局注）を行いますが、痛みが続く場合や感染を伴う場合には、外科的治療（早期のデブリードマン、ポケットの切開、植皮等）を要することもあり、皮膚科、形成外科へのご紹介もご検討ください。

### ■潰瘍、壊死等皮膚障害が生じた場合

本剤による静脈炎や皮膚障害は後期に重篤化することがあるため、1～4週間の十分な経過観察が必要になります。皮膚潰瘍や組織の壊死等が生じた場合には、外科的治療（早期のデブリードマン、ポケットの切開、植皮等）が必要で、皮膚科、形成外科へのご紹介もご検討ください。

## 2-4) 中心静脈から投与した場合の血栓性静脈炎等症例

- 高濃度投与 (0.2~1% : 3例、1%~ : 8例、不明 : 1例) によると考えられる中心静脈から投与した場合の血栓性静脈炎等の報告が12例あります。末梢からの投与と同様にご注意ください。

No.	性別 年齢 (歳)	使用理由 [合併症]	投与濃度 (%) (本剤mg/輸液mL)	投与 日数	併用薬	副作用 (発現日)	重篤度	治療	転帰	転帰日 (終了日から の日数)		
1	男 30代	急性膵炎 DIC [糖尿病]	1.2 (600/50) 5.0 (2500/50)	3	ファモチジン 生合成ヒトインスリン ウリナスタチン フロモキセフナトリウム	注射部位血栓性静脈炎 (終了3日後) 発熱 (終了3日後)	重篤	抗生剤 右頸部ドレナージ術 抗凝固療法	後遺症*	79日後		
				4			重篤		回復	79日後		
2	男 50代	DIC 急性膵炎	5.0 (2500/50) 5.0 (2500/50) 0.24 (600/250)	3	ウリナスタチン ナファモスタットメシル酸塩 スルバクタムナトリウム・セフォペラゾン ナトリウム	注射部位血栓性静脈炎 (終了1日後) 発熱 (終了2日後)	重篤	ボルタレン	回復	17日後		
				13			非重篤		回復	2日後		
				5								
3	男 50代	急性膵炎 DIC	0.06 (600/1000) 4.0 (2000/50) 0.06 (600/1000)	2	シチコリン ファモチジン ウリナスタチン フロモキセフナトリウム メロペネム水和物	注射部位血栓性静脈炎 (終了1日後) 発熱 (終了1日後)	重篤	ワーファリン パナルジン	軽快	44日後		
				8			重篤		回復	12日後		
				14								
4	男 50代	DIC [黄疸] [アルコール性 肝機能障害]	2.1 (1000/48)	57	ファモチジン メナトレノン 高カロリー輸液用総合ビタミン剤 塩化マンガン・硫酸亜鉛水和物配合剤 ブドウ糖 メロペネム水和物	注射部位血栓性静脈炎 (終了1日後) 発熱 (終了1日後)	重篤 重篤	不明	軽快 回復	30日後 4日後		
5	男 60代	急性膵炎 [DIC] [糖尿病性膵炎]	不明 (不明) 0.3 (1500/500) 0.1 (500/500) 0.04 (200/500)	不明	イミベネム水和物・シラスタチンナトリウム 含糖酸化鉄 スルバクタムナトリウム・セフォペラゾン ナトリウム ダイズ油 フロモキセフナトリウム	静脈血栓症 (終了4日後)	重篤	ワーファリン	不明	不明		
				6								
				6								
6	女 50代	DIC [小腸癌]	4.0 (2000/50)	8	ファモチジン グリチルリチン・グリシン・L-システイン メトクロプラミド セフメタゾールナトリウム ペンタゾシン ヒドロキシジシン塩酸塩	頸静脈血栓症 (終了6日後)	重篤	ヘパリン ウロキナーゼ ワーファリン	回復	28日後		
7	男 50代	急性膵炎 [なし]	0.4 (2000/500) 0.3 (1500/500) 0.2 (1000/500) 0.1 (500/500)	5	イミベネム水和物・シラスタチンナトリウム ウリナスタチン ファモチジン	注射部位血栓性静脈炎 (終了7日後)	重篤	ヘパリン ワーファリン	軽快	131日後		
				2								
				2								
8	女 90代	DIC [急性膵炎]	0.2 (500/250) 0.4 (1000/250)	1 7	不明	注射部位静脈炎 (投与7日目)	非重篤	なし	回復	71日後		
9	女 70代	膵炎 [高血圧]	0.4 (2000/500) 4 (2000/50)	11	ウリナスタチン イミベネム水和物・シラスタチンナトリウム シプロフロキサシン クリンダマイシンリン酸エステル シベレスタットナトリウム水和物 ミダゾラム 酒石酸アトルファノール ニカルジピン塩酸塩 ニトログリセリン	静脈血栓症 (投与24日目)	重篤	ヘパリン ワーファリン	後遺症**	92日後		
				24								
10	女 30代	急性膵炎 [なし]	4.2 (2000/48) 0.1 (576/500)	9	ファモチジン イミベネム水和物・シラスタチンナトリウム 高カロリー輸液用総合ビタミン剤 塩化マンガン・硫酸亜鉛水和物配合剤 シチコリン ブレンロフィン塩酸塩 耐性乳酸菌製剤 プロチゾラム 経腸成分栄養剤	注射部位血栓性静脈炎 (投与9日目) 肺塞栓症 (投与14日目 : 中止日)	重篤 重篤	ヘパリン ワーファリン	回復 未回復	6日後 75日後		
				5								
11	女 80代	凝固障害 [呼吸不全] [敗血症] [腹膜炎] [大腸癌]	不明 (不明)	不明	シベレスタットナトリウム水和物	静脈血栓症 (不明)	重篤	ヘパリン	回復	不明		
12	男 50代	DIC [敗血症]	4.2 (2000/48)	6	不明	深部静脈血栓症 (投与3日目)	重篤	ヘパリン	未回復	17日後		

\* 内頸静脈血栓症  
\*\* 下大静脈血栓

## 2-5) 非臨床試験のデータ

注射部位障害に関する非臨床試験の概要を以下にお示し致します。

### 局所刺激性試験 (*in vivo*)

#### 〈耳介静脈投与〉

ウサギの耳介静脈内に本剤を26週間反復投与した結果、0.4%の濃度で軽度の細胞浸潤及び浮腫、0.6～0.8%では投与部位炎症のため投与継続不能となり、著明な浮腫、うっ血が認められ、投与部位を中心に潰瘍の形成が認められました。

藤田 常夫 ほか：応用薬理, **9**(5)：743-760, 1975

#### 〈皮下投与〉

ラットの皮下に本剤を単回投与した結果、0.2%以下の濃度では生理食塩液対照群と同様にほとんど変化は認められませんでした。0.4～1.6%の濃度では中等度の細胞浸潤がみられ、3.2%以上の濃度では局所に発赤、腫脹、浮腫及び壊死が認められました。

松岡 康夫 ほか：応用薬理, **15**(1)：53-84, 1978

#### 〈頸静脈内投与〉

ウサギの頸静脈にカニューレを留置し本剤(1%)を30日間反復投与した結果、カニューレ挿入部位に血栓形成及び壊死が認められましたが、生理食塩液対照群でも同様の所見がみられ、両群間に差はありませんでした。

松岡 康夫 ほか：応用薬理, **15**(1)：53-84, 1978

## 蛋白分解酵素阻害剤

劇薬、処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注射用ガベキサートメシル酸塩

# 注射用エフオーワイ<sup>®</sup>100

FOY<sup>®</sup> 100 for Injection

薬価基準記載

日本標準商品分類番号

873999

承認番号	21700AMZ00065
薬価収載	2005年6月
販売開始	2018年12月
再審査結果	1989年1月(注射用エフオーワイ)
効能追加	1983年9月(注射用エフオーワイ)

貯法	室温保存
使用期限	3年(ラベル等に表示の使用期限を参照すること)

®登録商標

2018年12月作成(第1版)

注) 注意-医師等の処方箋により使用すること

### 【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	注射用エフオーワイ100
成分	ガベキサートメシル酸塩
含量	100mg
剤形	注射剤(バイアル)
pH	4.0~5.5 (本品1.0gを水10mLに溶かした液)
浸透圧比	1.1~1.3 (本品0.1gを5w/v%ブドウ糖注射液10mLに溶かした液)
性状	白色の塊、凍結乾燥品

### 【効能・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
- 汎発性血管内血液凝固症

### 【用法・用量】

- 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。
- 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。

### 【用法・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。

### 【使用上の注意】

- 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、痒疹、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。
- 副作用  
〈膵炎〉  
承認時の臨床試験及び市販後調査において副作用集計の対象となった3,893例中85例(2.2%)に117件の副作用(臨床検査値の異常を含む)が認められた。主なものは血管痛・静脈炎・発赤等注射部位に関するもの59例(1.5%)、発疹・痒疹等過敏症に関するもの25例(0.6%)、血圧降下5例(0.1%)、悪心・嘔吐等消化器系に関するもの12例(0.3%)等であった。(承認時及び1981年3月までの副作用頻度報告結果)  
〈汎発性血管内血液凝固症〉  
承認時の臨床試験及び市販後調査において副作用集計の対象となった1,952例中56例(2.9%)に68件の副作用(臨床検査値の異常を含む)が認められた。主なものは血管痛・静脈炎・発赤等注射部位に関するもの37例(1.9%)、発疹・痒疹等過敏症に関するもの5例(0.3%)、AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇等の肝機能異常5例(0.3%)等であった。(再審査終了時)  
(1) 重大な副作用  
1) ショック、アナフィラキシーショック：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(いずれも頻度不明\*)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：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(頻度不明\*)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：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(頻度不明\*)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、白血球減少、血小板減少：無顆粒球症(頻度不明\*)、白血球減少(0.03%)、血小板減少(頻度不明\*)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：高カリウム血症(頻度不明\*)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) その他の副作用

	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明*
過敏症 <sup>注1)</sup>	発疹、痒痒感等		
出血傾向 <sup>注2)</sup>		出血傾向亢進	
血液 <sup>注1)</sup>		顆粒球減少	好酸球増多
循環器	血圧降下		
肝臓	AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇等	黄疸	総ビリルビン上昇
その他	悪心	顔面潮紅、発熱	低ナトリウム血症

※：頻度不明は自発報告による。

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。

### 3. 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。

### 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。  
〔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。〕<sup>1)</sup>

### 5. 適用上の注意

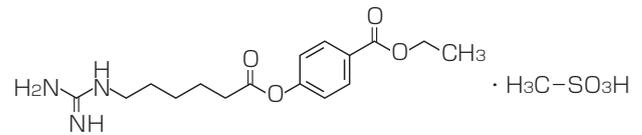
- 投与速度：点滴静注する場合、投与速度が増加すると血圧が低下することがあるので、ガベキサートメシル酸塩として体重1kg当たり毎時2.5mg以下とすることが望ましい。
- 投与時：薬液が血管外へ漏れると、注射部位に潰瘍・壊死を起こすことがあるので、薬液が血管外へ漏出しないよう注意すること。  
また、血液うっ滞が起こらないようできるだけ太い血管より投与すること。
- 調製時：1)溶解後はなるべく速やかに使用すること。  
2)他の注射剤(抗生物質製剤、血液製剤等)と配合した場合に、混濁等の配合変化を起こすことがあるので注意すること。  
また、アミノ酸輸液、アルカリ性の薬剤及び添加物として亜硫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。

## 【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

構造式：



分子式：C<sub>16</sub>H<sub>23</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>・CH<sub>4</sub>O<sub>3</sub>S

分子量：417.48

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。

融点：90～93℃

## 【包装】

注射用エフオーワイ100(100mg)：5バイアル、10バイアル、30バイアル

## 【主要文献】

- 藤田常夫他：応用薬理，9：743，1975

## 蛋白分解酵素阻害剤

劇薬、処方箋医薬品<sup>注</sup>

注射用ガベキサートメシル酸塩

薬価基準記載

日本標準商品分類番号

873999

承認番号 20100AMZ00948

薬価収載 1990年7月

販売開始 2018年12月

貯法 室温保存

使用期限 3年(ラベル等に表示の使用期限を参照すること)

®登録商標

# 注射用エフオーワイ<sup>®</sup>500

FOY<sup>®</sup> 500 for Injection

2018年12月作成(第1版)

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

### 【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	注射用エフオーワイ500
成分	ガベキサートメシル酸塩
含量	500mg
剤形	注射剤(バイアル)
pH	4.0~5.5(本品1.0gを水10mLに溶かした液)
浸透圧比	1.1~1.3(本品0.1gを5w/v%ブドウ糖注射液10mLに溶かした液)
性状	白色の塊、凍結乾燥品

### 【効能・効果】

汎発性血管内血液凝固症

### 【用法・用量】

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。

### 【用法・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。

### 【使用上の注意】

#### 1. 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、痒疹、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。

#### 2. 副作用

承認時の臨床試験及び市販後調査において副作用集計の対象となった1,952例中56例(2.9%)に68件の副作用(臨床検査値の異常を含む)が認められた。主なものは血管痛・静脈炎・発赤等注射部位に関するもの37例(1.9%)、発疹・痒疹等過敏症に関するもの5例(0.3%)、AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇等の肝機能異常5例(0.3%)等であった。(再審査終了時)

#### (1) 重大な副作用

- 1) ショック、アナフィラキシーショック：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(いずれも頻度不明\*)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：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(頻度不明\*)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：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(頻度不明\*)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、白血球減少、血小板減少：無顆粒球症(頻度不明\*)、白血球減少(0.03%)、血小板減少(頻度不明\*)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：高カリウム血症(頻度不明\*)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) その他の副作用

	0.1~1%未満	0.1%未満	頻度不明*
過敏症 <sup>注1)</sup>	発疹、痒疹感等		
出血傾向 <sup>注2)</sup>		出血傾向亢進	
血液 <sup>注1)</sup>		顆粒球減少	好酸球増多
循環器	血圧低下		
肝臓	AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇等	黄疸	総ビリルビン上昇
その他	悪心	顔面潮紅、発熱	低ナトリウム血症

\*：頻度不明は自発報告による。

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。

#### 3. 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ため減量するなど注意すること。

#### 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。〔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。〕<sup>1)</sup>

#### 5. 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1kg当たり毎時2.5mg以下とすることが望ましい。
- (2) 投与時：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、薬液が血管外へ漏れ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。

#### 【包装】

注射用エフオーワイ500(500mg)：10バイアル

#### 【主要文献】

- 1) 藤田常夫他：応用薬理，9：743，1975

●詳細は添付文書をご参照ください。添付文書の改訂にご留意ください。

2018年12月作成

資料請求先

丸石製薬株式会社

〒538-0042 大阪市鶴見区今津中2-4-2

2019年4月作成

FOY-Z12