＊2026年11月改訂（第2版）
2023年6月改訂（第1版）

日本標準商品分類番号
873999

経口蛋白分解酵素阻害剤

処方箋医薬品注）

*日本薬局方 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「トーワ」

CAMOSTAT MESILATE TABLETS 100mg “TOWA”

貯　　法：室温保存
有効期間：4年
注）注意－医師等の処方箋により使用すること

承認番号	22500AMX01134
販売開始	1996年7月

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. 組成・性状
3.1 組成

1錠中の有効成分	日局 カモスタットメシル酸塩 ……100mg
添加剤	乳糖水和物、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、マクロゴール6000、タルク、酸化チタン

3.2 製剤の性状

性状・剤形	白色～微黄白色のフィルムコーティング錠		
識別コード	Tw243		
外形	表 	裏 	側面 
直径(mm)	6.6		
厚さ(mm)	4.1		
質量(mg)	130		

4. 効能又は効果
〇慢性膵炎における急性症状の緩解
〇術後逆流性食道炎

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。

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。

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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意
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。
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。[1)]
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。

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。
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、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。
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]
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
過敏症注2)	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。

14. 適用上の注意
14.1 薬剤交付時の注意
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。

16. 薬物動態

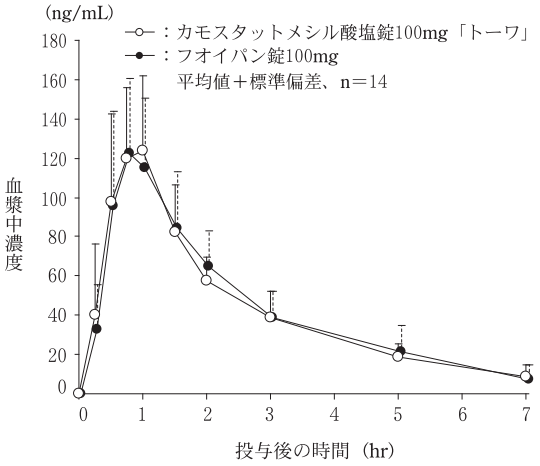
16.1 血中濃度

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73分である（HPLC法）。[2)]

16.1.2 生物学的同等性試験

カモスタットメシル酸塩錠100mg「トーワ」とフオイパン錠100mg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）健康成人男子に絶食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)フェニル酢酸の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。[3)]



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-7} (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「トーワ」	300.0±67.0	142.3±35.0	0.84±0.19	2.02±0.80
フオイパン錠100mg	305.1±82.4	138.5±34.3	0.82±0.18	1.83±0.59

（平均値±標準偏差、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。

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%が蛋白結合している。[4)]

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。[5)]

16.5 排泄

健康成人5例に600mg[注)]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。[2)]

注）本剤の承認された1日最大用量は通常600mg（3回分割投与）である。

17. 臨床成績

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。[6)]

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。[6)～17)]

〈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。[18)～22)]

18. 薬効薬理

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。[4),23),24),25)]

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、$C_{1\bar{r}}$、C_1エステラーゼに対して強い阻害作用を示す（*in vitro*）。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、α－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*）。[26),27)]
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。[4)]

(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。[28)]
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。[2)]

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。[23)]

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。[24)]

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。[29)]

(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。[30)]

(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。[31)]

18.2.5 術後逆流性食道炎モデルに対する作用

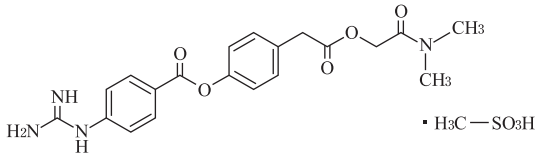
(1) ラット術後逆流性食道炎モデルにおいて、100mg/kgを1日2回術後2日目から5日間経口投与すると、食道粘膜潰瘍形成を抑制する。[25)]

(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。[32)]

(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。[25)]

＊19. 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-carbamimidoylaminobenzoyloxy)phenylacetate monomethanesulfonate

分子式：$C_{20}H_{22}N_4O_5 \cdot CH_4O_3S$

分子量：494.52

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。

融　点：194～198℃

22. 包装

100錠［10錠×10：PTP］
1000錠［10錠×100：PTP］
1000錠［バラ、乾燥剤入り］

23. 主要文献

1）市川祐三ほか：現代医療，1980；12(臨)：127-152
2）平工誠治ほか：医薬品研究，1982；13：756-765
3）社内資料：生物学的同等性試験
4）第十八改正日本薬局方解説書，2021：C-1355-1359
5）大木史郎ほか：現代医療，1980；12(臨)：71-82
6）石井兼央ほか：現代医療，1984；16：844-854
7）平山亮夫ほか：現代医療，1980；12(臨)：253-260
8）石井兼央ほか：現代医療，1980；12(臨)：261-278
9）平山亮夫ほか：現代医療，1980；12(臨)：245-252
10）早川哲夫ほか：現代医療，1980；12(臨)：239-244
11）堀口祐爾ほか：現代医療，1980；12(臨)：227-231
12）久保田義弘ほか：現代医療，1980；12(臨)：211-214
13）藤原淳ほか：現代医療，1980；12(1)：104-107
14）安部宋顕ほか：現代医療，1980；12(臨)：233-238
15）田中紀男ほか：現代医療，1980；12(臨)：223-226
16）広野禎介：現代医療，1980；12(臨)：215-218
17）木南義男ほか：現代医療，1980；12(1)：108-114
18）佐藤寿雄ほか：臨床医薬，1992；8(8)：1877-1891
19）佐藤寿雄ほか：臨床医薬，1992；8(8)：1893-1908
20）杉山貢ほか：現代医療，1993；25(増Ⅱ)：1835-1843
21）神津照雄ほか：現代医療，1992；24(増Ⅳ)：3567-3574
22）渡辺正敏ほか：現代医療，1992；24(増Ⅳ)：3575-3582
23）小畠隆明ほか：現代医療，1980；12(臨)：19-25
24）小畠隆明ほか：現代医療，1980；12(臨)：27-33
25）川澤和一十ほか：薬理と治療，1992；20：3517-3525
26）Tamura Y. et al. ：Biochim. Biophys. Acta. , 1977；484：417-422
27）加山直宏ほか：現代医療，1980；12(臨)：1-10
28）加山直宏ほか：現代医療，1980；12(臨)：11-18
29）桶川忠夫ほか：現代医療，1980；12(臨)：35-40
30）Takasugi S. et al. ：Digestion，1982；24：36-41
31）桶川忠夫ほか：現代医療，1980；12(臨)：41-49
32）渡辺正敏ほか：現代医療，1994；26(増Ⅲ)：2983-2988

24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター
〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号
TEL 0120-108-932 FAX 06-7177-7379

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

東和薬品株式会社
大阪府門真市新橋町2番11号