



貯法	室温保存 開封後は湿気を避けて保存のこと
使用期限	外箱、容器に使用期限を表示

日本標準商品分類番号	872329
------------	--------

承認番号	21800AMX10271
薬価収載	2006年6月
販売開始	1993年12月
効能追加	1995年11月
再審査結果	2003年1月

胃炎・胃潰瘍治療剤

日本薬局方 エカベトナトリウム顆粒

ガストローム® 顆粒66.7%

GASTROM® Granules 66.7%

(エカベトナトリウム製剤)

【組成・性状】

販売名	ガストローム顆粒66.7%
成分・含量 (1g中)	日局 エカベトナトリウム水和物 0.667g
添加物	アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、 塩化ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、 二酸化ケイ素、D-マンニトール、トメントール
剤形	顆粒剤
色調	白色

【効能・効果】

- 胃潰瘍
- 下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善
急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期

【用法・用量】

通常、成人には本剤を1回1.5g(エカベトナトリウム水和物として1g)、1日2回(朝食後、就寝前)経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 副作用

臨床試験(治験)：総症例729例中、副作用が報告されたのは6例(0.82%)で、副作用は発疹、蕁麻疹、便秘、下痢、胸部圧迫感、全身倦怠感各1件(0.14%)であった。

使用成績調査(承認時～再審査期間終了時)：総症例5,715例中、副作用が報告されたのは53例(0.93%)で、主な副作用は悪心13件(0.23%)、便秘10件(0.17%)、下痢7件(0.12%)、腹部膨満感7件(0.12%)等であった。

副作用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。

種類	頻度	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症			発疹、蕁麻疹、 そう痒感	
肝臓				肝機能障害、 黄疸
消化器	悪心、下痢、便秘、 腹部膨満感		嘔吐、腹痛	
その他			胸部圧迫感、 全身倦怠感	

2. 高齢者への投与

本薬はほとんど吸収されず、非高齢者に比べて高齢者で特別に注意する点はないと考えられるが、一般に高齢者では消化器機能が低下しているため、便秘等の発現には注意することが望ましい。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合のみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

2) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。〔授

乳中の投与に関する安全性は確立していない。〕

4. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

【薬物動態】

1. 血中濃度¹⁾

健康成人にエカベトナトリウム水和物1.0gを経口投与した場合、血漿中濃度は投与後2～5時間で最高の約1μg/mLに到達し、以後約8時間の半減期で血中より消失した。

2. 代謝・排泄¹⁾

健康成人にエカベトナトリウム水和物1.0gを経口投与した場合、エカベトナトリウム水和物は代謝されることなく、72時間までに投与量の約3%が尿中に、90%以上が糞便中に未変化体として排泄された。

3. 分布(参考)^{2,3)}

ラット及びイヌを用いた試験において消化管からの吸収率は低く、ほとんど未吸収のまま大部分が糞中に排泄された。

体内への分布は少なく、また、代謝物としてグルクロン酸抱合体が若干尿中に排泄されることが認められた。

【臨床成績】

1. 臨床効果

1) 胃潰瘍⁴⁻⁸⁾

胃潰瘍患者を対象にした二重盲検比較試験を含む臨床試験(339例)において、内視鏡判定による治癒率(略治以上)は、62.8%であった。また、心窩部痛、圧痛、悪心、嘔吐、腹部膨満感等の諸症状を改善した。

2) 急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期⁹⁻¹²⁾

胃炎患者を対象にした二重盲検比較試験を含む臨床試験(297例)において、内視鏡判定による改善率(中等度改善以上)は84.5%であった。また、心窩部痛、胃部不快感、悪心、食欲不振、腹部膨満感、胃重感等の諸症状を改善した。

*【薬効薬理】

1. 胃粘膜被覆保護(バリアー)作用¹³⁻¹⁷⁾

- ラット及び患者の胃粘膜障害部位に選択的に結合し、胃液の侵襲から胃粘膜を被覆保護した。
- ラット及び患者における胃粘膜被覆作用は変動する胃内pHの影響を受けなかった。

2. ペプシン活性抑制作用¹⁸⁻²¹⁾

- ラット及び健康成人の胃液ペプシン活性を抑制した。
- ペプシン及びペプシノーゲン蛋白と結合し、不溶化することによりペプシン活性を抑制した(in vitro)。

3. *Helicobacter pylori*に対する作用²²⁻²⁵⁾

- Helicobacter pylori*のウレアーゼ活性を阻害した(in vitro)。
- 酸性環境下の*Helicobacter pylori*に対し、ウレアーゼ活性阻害作用を伴う殺菌作用を示した(in vitro)。
- サルにおいて*Helicobacter pylori*の制菌作用及び定着阻止作用が認められた。

4. 内因性プロスタグランジン増加作用^{26, 27)}

- ・ラットにおいて胃粘膜内のプロスタグランジン(PGE₂, PGI₂)の産生能を亢進させた。
- ・患者において胃粘膜内のプロスタグランジン(PGE₂, PGI₂)含量を増加させた。

5. 防御因子増強作用

1) 胃粘液分泌促進作用^{19, 26, 28)}

- ・ラット及び患者において胃粘液量を増加させた。
- ・健康成人において胃粘液の分泌を持続的に増加させた。

2) 胃粘膜血流改善作用²⁸⁾

- ・ラットにおいてエタノールによる胃粘膜血流量の減少を抑制した。

3) 胃アルカリ(HCO₃⁻)分泌増加作用²⁸⁾

- ・ラットにおいて胃アルカリ分泌を増加させた。

6. 胃粘膜損傷形成抑制作用・潰瘍治癒促進作用

1) 胃粘膜損傷形成抑制作用^{18, 28~30)}

- ・ラットにおいてエタノール、塩酸、水酸化ナトリウム、熱湯、アスピリン、アンモニア、塩酸・胆汁酸等の壊死性物質による胃粘膜損傷を抑制した。
- ・健康成人においてアスピリン負荷による胃粘膜出血を抑制した。
- ・ラットにおいて幽門結紮胃潰瘍の発生を抑制した。

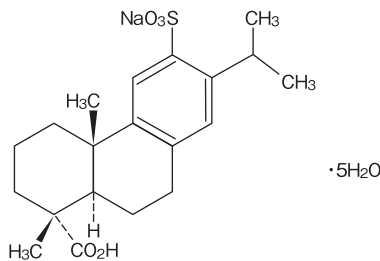
2) 潰瘍治癒促進作用³¹⁾

- ・ラットにおける酢酸胃潰瘍に対して治癒促進効果が認められた。

【有効成分に関する理化学的知見】

○一般名：エカベトナトリウム水和物(Ecabet Sodium Hydrate)

**○化学名：(1R,4aS,10aR)-1,4a-Dimethyl-7-(1-methylethyl)-6-sodiosulfonato-1,2,3,4,4a,9,10,10a-octahydrophenanthrene-1-carboxylic acid pentahydrate



C₂₀H₂₇NaO₅S·5H₂O : 492.56

○性状：

- ・白色の結晶である。
- ・メタノールに溶けやすく、水又はエタノール(99.5)に溶けにくい。
- ・水酸化ナトリウム試液に溶ける。
- ・1.0gを水200mLに溶かした液のpHは約3.5である。

**【包装】

ガストローム顆粒66.7%：

- 168g(1.5g× 112包)
- (112包：[(2包×7)×4]×2束),
- 840g(1.5g× 560包)
- (560包：[(2包×7)×4]×10束),
- 1kg

*【主要文献】

- 1) 東 純一 他：田辺製薬研究報告 1992；45-56
- 2) Ito, Y. et al. : J. Pharmacobio-dyn. 1991；14：533-546
- 3) 山北博一 他：田辺製薬研究報告 1992；39-44
- 4) 三好秋馬 他：Progress in Medicine 1991；11(2)：293-303
- 5) 三好秋馬 他：Progress in Medicine 1991；11(2)：305-325
- 6) 三好秋馬 他：Progress in Medicine 1991；11(5)：1326-1346
- 7) 佐藤信紘 他：Progress in Medicine 1991；11(3)：714-733
- 8) 土屋雅春 他：新薬と臨牀 1991；40(3)：498-521
- 9) 三好秋馬 他：診断と治療 1994；82(7)：1203-1223
- 10) 三好秋馬 他：Progress in Medicine 1994；14(7)：1999-2013
- 11) 三好秋馬 他：診断と治療 1994；82(12)：2193-2217
- 12) 川野 淳 他：Progress in Medicine 1994；14(7)：2014-2026
- 13) Ito, Y. et al. : J. Pharmacobio-dyn. 1991；14：547-554
- 14) Ito, Y. et al. : Jpn. J. Pharmacol. 1993；62：175-181
- 15) 三澤 正 他：新薬と臨牀 1991；40(4)：727-732
- 16) Kinoshita, M. et al. : Dig. Dis. Sci. 1995；40(3)：661-667
- 17) 浅田修二 他：臨牀と研究 1994；71(9)：2439-2443
- 18) Onoda, Y. et al. : Jpn. J. Pharmacol. 1989；51：65-73
- 19) 浅田修二 他：Progress in Medicine 1991；11(2)：335-342
- 20) 井上正規 他：Progress in Medicine 1991；11(2)：327-334
- 21) Ito, Y. et al. : Jpn. J. Pharmacol. 1993；62：169-174
- 22) Shibata, K. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 1995；39(6)：1295-1299
- 23) 芝田和夫 他：田辺製薬研究報告, 1993；1-5
- 24) Fukuda, Y. et al. : Scand. J. Gastroenterol. 1994；29(11)：1055-1056
- 25) Masubuchi, N. et al. : Am. J. Gastroenterol. 1994；89(8)：1381-1381
- 26) Kohli, Y. et al. : J. Kyoto Pref. Univ. Med. 1990；99(9)：1085-1090
- 27) Kinoshita, M. et al. : Biol. Pharm. Bull. 1993；16(12)：1220-1225
- 28) Onoda, Y. et al. : Jpn. J. Pharmacol. 1990；52：631-638
- 29) 阿部真一郎 他：新薬と臨牀 1991；40(4)：719-724
- 30) 木下美弥 他：応用薬理 1994；47(1)：59-66
- 31) Onoda, Y. et al. : Arzneimittelforschung 1991；41(5)：546-548

*【文献請求先】

田辺三菱製薬株式会社 くすり相談センター
〒541-8505 大阪市中央区道修町3-2-10
電話 0120-753-280

*



製造販売元

田辺三菱製薬株式会社
大阪市中央区道修町3-2-10