

日本標準商品分類番号
872329

貯法	室温保存 開封後は高温、湿気を避けて保存のこと
使用期限	外箱に使用期限を表示
規制区分	劇薬、処方せん医薬品(注意-医師等の処方せんにより使用すること)

	カプセル12.5	カプセル25
承認番号	20700AMZ00424	20500AMZ00001
薬価収載	1995年6月	1993年3月
販売開始	1995年8月	1993年3月
再審査結果	2003年1月	

胃潰瘍治療剤(持続型 PGE₂誘導体)

カムリード®カプセル12.5 カムリード®カプセル25



CAMLEED® Capsules12.5・Capsules25

(エンプロスチル製剤)

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人〔妊婦、産婦、授乳婦等への投与〕の項参照

【組成・性状】

販売名	カムリードカプセル12.5	カムリードカプセル25
成分・含量 (1カプセル中)	エンプロスチル	
	12.5 μg	25 μg
剤形	軟カプセル剤	
添加物	還元麦芽糖水アメ、グリセリン、セラチン、D-ソルビトール 添加物としてその他1成分を含有する	
色調	淡黄褐色(内容物は無色澄明の液)	
外形		
サイズ(mm)	長径: 13.1 短径: 5.7	長径: 13.0 短径: 7.7
重さ(g)	0.34	0.52
包装コード	TA306	TA305

【効能・効果】

胃潰瘍

【用法・用量】

通常、成人にはエンプロスチルとして1日量50μgを2回(朝、夕)に分けて経口投与する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

薬物過敏症の既往歴のある患者

2. 副作用

臨床試験(治験): 総症例541例中、副作用が報告されたのは52例(9.61%)で、主な副作用は下痢28件(5.18%)、悪心10件(1.85%)、腹部膨満感6件(1.11%)、腹痛4件(0.74%)、嘔吐4件(0.74%)等であった。

使用成績調査(承認時~再審査期間終了時): 総症例4,732例中、副作用が報告されたのは213例(4.50%)で、主な副作用は下痢93件(1.97%)、腹部膨満感44件(0.93%)、腹痛43件(0.91%)、悪心34件(0.72%)、胸やけ9件(0.19%)、発疹9件(0.19%)、嘔吐7件(0.15%)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
過敏症	発疹		そう痒感
消化器	軟便、下痢、便秘、悪心、嘔吐、食欲不振、胸やけ、腹部膨満感、腹痛		おくび
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、ALPの上昇		
その他			顔面潮紅、月経異常

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、副作用症状(下痢等)の発現に注意しながら低用量(例えば25μg/日(分2))から投与を開始するなど慎重に投与することが望ましい。

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投与しないこと。〔動物実験において子宮収縮作用(妊娠ラット、妊娠サル)、胎児毒性(ウサギ: 致死)、新生児毒性(ラット: 発育抑制)が報告されている。〕
- 授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。〔動物実験(ラット)において微量ではあるが乳汁中への移行が認められている。〕

5. 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)。

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、更には穿孔をお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. 吸収・血中濃度¹⁾

本剤は腸管吸収後血中へ移行しての作用も有するが、胃粘膜への直接作用もある。健康成人男子6例にエンプロスチル75μgを経口投与したとき、血中エンプロスチル濃度は検出限界(25pg/mL)以下であった。同方向性の薬理活性を持つ主代謝物エンプロスチル酸の血漿中濃度は投与後約50分で最高131±9pg/mLに達し、以後約40分の半減期で血中より消失する。
(注)本剤の承認された1回用量は25μgである。

2. 代謝・排泄

外国人のデータでは、健康成人に³H-エンプロスチル1μg/kgを経口投与したとき、エンプロスチルはメチルエステルの加水分解物であるエンプロスチル酸を経たのち、さらに9位カルボニル基の還元や、アレン側鎖のβ-酸化を受ける。投与後24時間までに投与量の約46%(尿中に約41%、糞中に約5%)が、6日までに約83%(尿中に約45%、糞中に約38%)が排泄される。

【臨床成績】

胃潰瘍治療効果^{2~5)}

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において、内視鏡判定による治癒率(略治以上)は80.1%(165/206)、全般改善度(中等度改善以上)は86.6%(194/224)であり、心窩部痛、悪心・嘔吐及び腹部膨満感等の症状を改善した。

【薬効薬理】

攻撃因子抑制作用と防御因子増強作用を併せ持つ持続型プロスタグランジンE₂誘導体の潰瘍治療剤である。

1. 攻撃因子抑制作用

胃酸分泌抑制作用

- ・健康成人において基礎分泌及びテトラガストリンによる刺激分泌を抑制する。^{6,7)}
- ・患者において1日2回投与で胃内平均H⁺ activityを24時間持続的に抑制する。⁸⁾
- ・ラットにおいて基礎分泌及びヒスタミン、ペントガストリンによる刺激分泌を抑制する。^{9,10)}

2. 防御因子増強作用

1) 胃粘液分泌促進作用

- ・患者において胃粘膜糖蛋白質(ヘキソサミン)量を増加させる。¹¹⁾
- ・ラットにおいて塩酸・アスピリンで障害をうけた胃粘膜の粘液分泌を促進させる。¹²⁾

2) 胃粘膜血流増加作用

- ・健康成人及び患者において胃粘膜血流量を増加させる。¹¹⁾
- ・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する。¹³⁾

3) 胃アルカリ(HCO₃⁻)分泌増加作用

- ・健康成人においてアルカリ分泌を増加させる。¹⁴⁾

3. 血中ガストリン濃度上昇抑制作用

- ・健康成人において食後の血中ガストリン濃度の上昇を抑制する。¹⁵⁾
- ・イス、サルにおいて摂食後の血中ガストリン濃度の上昇を抑制する。^{9,16)}

4. 実験潰瘍及び粘膜障害に対する作用

1) 胃粘膜細胞保護作用(サイトプロテクション)

- ・ヒトにおいてタウロコール酸惹起障害による胃粘膜電位(ポテンシャルディファレンス: 粘膜抵抗能の指標の一つ)の低下を抑制し、上皮細胞脱落の防止がみられた。¹⁷⁾
- ・ラットにおいて塩酸・エタノール、熱湯、塩酸・アスピリンによる胃粘膜傷害の発生を抑制する。^{10,18)}

2) 潰瘍発生抑制作用

- ・健康成人においてアスピリン誘発の胃粘膜損傷を抑制する。^{19,20)}
- ・ラットにおいてアスピリン、インドメタシン、インドメタシン・寒冷ストレス、水浸ストレスあるいは幽門結紮によって生じる胃潰瘍の発生を抑制する。^{10,18)}

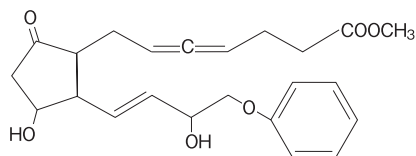
3) 潰瘍治癒促進作用

- ・ラットにおける慢性潰瘍(酢酸潰瘍)に対し、治癒促進効果が認められる。¹⁰⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

○一般名: エンプロステル(Enprostil)

○化学名: methyl(±)-7-[(1R*,2R*,3R*)-3-hydroxy-2-[(E)-(3R*)-3-hydroxy-4-phenoxy-1-butenyl]-5-oxocyclopentyl]-4,5-heptadienoate



C₂₃H₂₈O₆: 400.47

○性状:

- ・無色～淡黄色の粘稠性のある液又は白色～淡黄色のろう状の塊。
- ・メタノールに極めて溶けやすく、エタノール(99.5)又は酢酸エチルに溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けにくく、水にはほとんど溶けない。
- ・融点: 46～51℃

【包装】

カムリードカプセル12.5:

100カプセル(10カプセル×10)

カムリードカプセル25:

100カプセル(10カプセル×10),

500カプセル(10カプセル×50)

【主要文献】

- 1) 大柴三郎 他: 基礎と臨床 1989; 23(7): 2667-2671
- 2) 三好秋馬 他: Progress in Medicine 1989; 9(1): 126-137
- 3) 三好秋馬 他: Progress in Medicine 1989; 9(1): 138-164
- 4) 三好秋馬 他: Progress in Medicine 1989; 9(1): 166-185
- 5) 三澤 正 他: 現代医療 1989; 21: 1019-1030
- 6) Moriga, M. et al.: Gastroenterol. Jpn. 1989; 24(2): 115-119
- 7) 平沢頼久 他: 薬理と治療 1988; 16(12): 4913-4920
- 8) 早川 滉: 薬理と治療 1988; 16(12): 4901-4906
- 9) Wong, A. G. et al.: Proc. West. Pharmacol. Soc. 1989; 32: 49-56
- 10) 岡部 進 他: Ther. Res. 1987; 7(4): 937-949
- 11) Kohli, Y. et al.: 京都府立医科大学雑誌 1988; 97(11): 1421-1428
- 12) Waterbury, L. D. et al.: Proc. West. Pharmacol. Soc. 1988; 31: 21-23
- 13) 村上元庸 他: Ther. Res. 1989; 10(4): 1587-1591
- 14) Shorrock, C. J. et al.: Dig. Dis. Sci. 1989; 34(7): 1016-1020
- 15) 原澤 茂 他: 薬理と治療 1988; 16(12): 4907-4911
- 16) Fisher, P. E. et al.: Proc. West. Pharmacol. Soc. 1988; 31: 37-40
- 17) 坂上 博 他: 基礎と臨床 1989; 23(3): 1125-1129
- 18) Wong, A. G. et al.: Proc. West. Pharmacol. Soc. 1989; 32: 41-47
- 19) Stiel, D. et al.: Am. J. Med. 1986; 81(Suppl.2A): 54-58
- 20) Hawkey, C. J. et al.: Am. J. Med. 1986; 81(Suppl.2A): 50-53

**【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 大阪市中央区北浜2-6-18
電話 0120-753-280

**



製造販売元

田辺三菱製薬株式会社

大阪市中央区北浜2-6-18