

위염·위궤양 치료제(232)

가스트렉스® 과립

(에카베트 나트륨)

GASTREX® Granules**【개요 및 특징】**

가스트렉스®는 송향성분의 유도체로부터 개발한 위염·위궤양치료제(일반명:에카베트 나트륨)입니다. 위점막과 결합하여 피복층(barrier)을 형성하여, 공격인자의 침습으로부터 위점막을 보호합니다. 그리고 캡시노겐단백 및 캡신단백에 결합하여 이들의 산소화성을 억제함과 동시에, 내인성 프로스타글란딘(PGE₂, PGL₂)을 증가시켜, 점액, 점막혈류, 위알칼리 분비 등의 방어인자를 증가시킵니다. 또한 위염과 위궤양에 관련이 있다고 알려진 *Helicobacter pylori*의 Urease활성을 저해함으로써 살균작용을 나타내어 밝혀졌습니다.

【원료약품의 분량】 이 약 1포(1.5g) 중

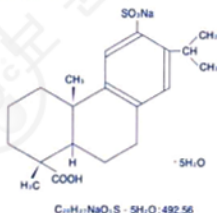
에카베트 나트륨(별규) 1.0g

【성상】

이 약은 백색의 과립제로 냄새는 없거나 약간 특이한 냄새가 있고 특이한 맛이 있습니다.

• 一般名 : 에카베트 나트륨(Ecabet Sodium)

• 化學名 : (+)-(1R, 4aS, 10aR)-1,2,3,4,4a,9,10,10a-octa-hydro-1, 4a-dimethyl-7-(1-methylethyl)-6-sulfo-1-phenanthrenecarboxylic acid 6-sodium salt pentahydrate

**【효능·효과】**

• 위궤양

• 다음 질환의 위점막 병변(미란, 출혈, 말직, 부종)의 개선 : 급성 위염, 만성 위염의 급성 악화기

【용법·용량】

보통 성인은 1회 가스트렉스 과립 1.5g(에카베트 나트륨으로서 1g)을 1일 2회 경구 복용합니다(아침식사 후, 취침 전). 환자의 연령과 증상에 따라서 적절히 증감합니다.

【사용상의 주의사항】**1. 경고**

이 약에 함유되어 있는 인공감미제 아스파탐은 체내에서 분해되어 페닐알라닌으로 대사되므로, 페닐알라닌의 섭취를 규제할 필요가 있는 유전성 질환인 페닐케톤뇨증 환자에는 부여해서는 안됩니다.

2. 이상반응

매우 흔하게($\geq 1/10$), 흔하게($\geq 1/100$, $< 1/10$), 때때로($\geq 1/1000$, $< 1/100$), 드물게($\geq 1/10,000$, $< 1/1,000$), 매우 드물게($< 1/10,000$)로 구분하여 나타내었습니다.

이상반응이 인정된 경우에는 필요에 따라서 감량 또는 중지 등 적절한 조치를 취하십시오.

- 1) 과민증 : 드물게 발진, 가려움증, 두드러기가 발생할 수 있습니다.
- 2) 소화기계 : 때때로 변비, 설사, 복부팽만감, 오심이 발생할 수 있고, 드물게 구토, 복통이 발생할 수 있습니다.
- 3) 간장 : 간기능장애, 황달이 나타날 수 있습니다(빈도불명).
- 4) 기타 : 드물게 흉부압박감, 전신 권태감이 발생할 수 있습니다.
- 5) 국내 시판후 조사결과 : 국내에서 제1차시사를 위하여 6년 동안 4,600명을 대상으로 실시한 시판후 조사결과 이상반응의 발현종래율은 인과관계와 상관없이 0.37%(17례/4,600례)로 보고되었고, 이 중 이 약과 인과관계가 있는 것으로 조사된 것은 0.30%(14례/4,600례)입니다. 간기능장애가 0.09%(4례/4,600례)로 가장 많았고, 그 다음은 설사 0.07%(3례/4,600례), 복부팽만감, 오심 0.04%(2례/4,600례), 변비, 복통, 신물, 두드러기, 발진 0.02%(1례/4,600례)의 순으로 나타났습니다. 이 중 시판전 임상시험에서 나타나지 않았던 새로운 이상반응으로 복통, 신물이 각 1례씩 보고되었습니다.

3. 임부·수유부에 대한 부여

- 1) 임신 중 부여에 대한 안전성이 확인되어 있지 않으므로, 임부 또는 임신하고 있을 가능성이 있는 부인에게는 치료상의 유효성이 위험성을 상회한다고 판단되는 경우에만 부여하십시오.
- 2) 수유 중 부여에 관한 안전성은 확인되어 있지 않으므로 수유 중인 부인에게 부여하는 것을 피하고, 부득이하게 부여하는 경우에는 수유를 중지하십시오.

4. 소아에 대한 부여

소아에 대한 안전성은 확인되어 있지 않습니다(사용경험이 없습니다).

5. 고령자에 대한 부여

기의 흡수가 되지 않으므로 비교령자에 비해서 특별히 주의할 필요는 없지만 일반적으로 고령자는 소화기계 기능이 저하되어 있으므로, 변비 등의 발생에 주의할 필요가 있습니다.

6. 기타

동물용 이용한 생식독성 시험 결과, 랫트를 이용한 수태능 및 일반 생식 독성 시험에서 3000mg/kg/day를 경구투여 시 정 자형태 이상 발현율(1.6%)이 증가하였습니다.

【약효·약리】**1. 위점막 피복보호(barrier)작용⁽¹⁾⁽⁵⁾**

- Rat 및 환자의 위점막 장하부위에 선택적으로 결합하여, 위액의 침습으로부터 위점막을 피복보호했습니다.
- Rat 및 환자에서의 위점막 피복보호작용은 변동하는 위내 pH의 영향을 받지 않았습니다.

2. 캡시노겐 억제작용⁽⁶⁾⁽⁹⁾

- Rat 및 건강한 상인의 위액의 캡시노겐을 억제했습니다.
- 캡시 및 캡시노겐 단백질과 결합하여 불용화함으로써 캡시노겐을 저해했습니다(in vitro).

3. *Helicobacter pylori*에 대한 작용⁽¹⁰⁾⁽¹⁵⁾

- *Helicobacter pylori*의 Urease를 저해했습니다(in vitro).
- 산성환경하의 *Helicobacter pylori*에 대하여 Urease의 저해작용과 동시에 살균작용을 나타냈습니다(in vitro).
- 인공소에서 *Helicobacter pylori*의 재균작용 및 정착저지작용이 확인되었습니다.
- *Helicobacter pylori* 양성환자에서 *Helicobacter pylori*의 음성화가 확인되었습니다.

4. 내인성 프로스타글란딘 증가작용⁽¹⁶⁾⁽¹⁷⁾

- Rat에서 위점막내의 프로스타글란딘(PGE₂, PGL₂) 생산능을 항진시켰습니다.
- 환자에서 위점막내 프로스타글란딘(PGE₂, PGL₂) 함량을 증가시켰습니다.

5. 방어인자 증가작용

- 1) 위점액분비 촉진작용^{2, 16, 18)}
 - Rat 및 환자에서 위점액량을 증가시켰습니다.
 - 건강한 성인에 있어서 위점액의 분비를 지속적으로 증가시켰습니다.
- 2) 위점막 혈류개선작용¹⁸⁾
 - Rat에서 에탄올에 의한 위점막 혈류량의 감소를 억제했습니다.
- 3) 위알칼리(HCO₃⁻) 분비증강작용¹⁸⁾
 - Rat에서 위알칼리 분비를 증가시켰습니다.
- 6) 위점막 손상형성억제작용·폐양치유 촉진작용
 - 1) 위점막 손상형성억제작용^{6, 19-20)}
 - Rat에서 에탄올, 염산, 수산화나트륨, 열탕, 아스피린, 암모니아, 염산·담즙산 등의 괴사성 물질에 의한 위점막 손상을 억제하였습니다.
 - 건강한 성인에서 아스피린 부하에 의한 위점막출혈을 억제했습니다.
 - Rat에서 유문결찰위궤양의 발생을 억제하였습니다.
 - 2) 폐양치유 촉진작용²¹⁾
 - Rat에서 초산위궤양에 대하여 치유촉진효과가 확인되었습니다.

[체내약물동태]

1. 혈중농도²²⁾

건강성인에 에카베트 나트륨 1.0g을 경구투여했을때, 혈장 중 농도는 투여 후 2~5시간에 최고인 약 1μg/mL에 도달하여, 이후 약 8시간의 반감기를 거쳐 혈중으로부터 소실되었습니다.
2. 대사·배설²²⁾

건강한 성인에 에카베트 나트륨 1.0g을 경구투여했을때, 에카베트 나트륨은 대사되지 않고, 72시간까지 투여량의 약 3%가 요중으로, 90% 이상이 분변중에 미변화체로서 배설되었습니다.
3. 분포²³⁻²⁴⁾

Rat 및 개를 사용한 시험에 있어서 소화관에서의 흡수율이 낮았으며, 대부분이 미흡수된 채 분변중에 배설되었습니다. 체내의 분포는 적었고, 또한 대사물로서 글루쿠론산 복합체가 약간 요중에 배설되는 것이 확인되었습니다.

[임상작용]

1. 임상효과

- 1) 위궤양²⁵⁻²⁹⁾

위궤양환자를 대상으로 한 이중맹검비교시험을 포함한 임상시험(339예)에서, 내시경관찰에 의한 치유율(약치이상)은 62.8%였습니다. 그리고 심와부통, 압통, 오심, 구토, 복부팽만감 등의 여러 증상을 개선시켰습니다.
- 2) 급성위염, 만성위염의 급성악화기³⁰⁻³³⁾

위염환자를 대상으로 한 이중맹검비교시험을 포함한 임상시험(297예)에서, 내시경관찰에 의한 개선율(중등도개선이상)은 84.5%이었습니다. 그리고 심와부통, 위부불쾌감, 오심, 식욕부진, 복부팽만감, 위증감 등의 여러 증상을 개선시켰습니다.
2. 시판 후 부작용 보고(일본)

총 조사 수 6,445예 중 부작용이 보고된 50예(0.92%)에서 주요 부작용은 오심 13예(0.20%), 변비 11예(0.17%), 설사 8예(0.12%), 복부팽만감 7예(0.11%) 등이 있었습니다.

	0.1% ~ 5% 미만	0.1% 미만
과 민 병		발진, 두드러기, 가려움증
간 장		GOT, GPT 상승
소 화 기	오심, 설사, 변비, 복부팽만감	구토, 복통
기 타		홍부압박감, 전신권태감

[저장방법] 기밀용기, 실온(1~30℃)보관

[포장단위] 자사포장단위

[참고문헌]

- 1) Ito Y et al : J pharmacobiodyn 14 547 (1991)
- 2) Ito Y et al : Jpn J Pharmacol 62 175 (1993)
- 3) 三澤 正ら : 新藥と臨牀 40 727 (1991)
- 4) Kinoshita M et al : Dig Dis Sci 40 661 (1995)
- 5) 淺田 修二ら : 臨牀と研究 71 2439 (1994)
- 6) Onoda Y et al : Jpn J Pharmacol 51 65 (1989)
- 7) 淺田 修二ら : Progress in Medicine 11 335 (1991)
- 8) 井上 正規ら : Progress in Medicine 11 327 (1991)
- 9) Ito Y et al : Jpn J Pharmacol 62 169 (1993)
- 10) Shibata K et al : Antimicrob Agents Chemother 39 1265 (1995)
- 11) 芝田 和夫ら : 田邊製藥研究報告 p1 (1993)
- 12) Fukuda Y et al : Scand J Gastroenterol 29 1055 (1994)
- 13) 増淵 尚子ら : 日本消化器病學會誌 投稿中
- 14) 隅井 浩治ら : 新藥と臨牀 42 2248 (1993)
- 15) 藤岡 利生ら : 醫學と藥學 31 241 (1994)
- 16) Kohli Y et al : J Kyoto Pref Univ Med 99 1085 (1990)
- 17) Kinoshita M et al : Biological & Pharmaceutical Bulletin 16 1220 (1993)
- 18) Onoda Y et al : Jpn J Pharmacol 52 631 (1990)
- 19) 阿部旗一郎ら : 新藥と臨牀 40 719 (1991)
- 20) 木下 美彌ら : 應用藥理 47 59 (1994)
- 21) Onoda Y et al : Arzneimittelforschung 41 546 (1991)
- 22) 東 純一ら : 田邊製藥研究報告 p45 (1992)
- 23) Ito Y et al : J Pharmacobiodyn 14 533 (1991)
- 24) 山北博一ら : 田邊製藥研究報告 p39 (1992)
- 25) 三好 秋馬ら : Progress in Medicine 11 293 (1991)
- 26) 三好 秋馬ら : Progress in Medicine 11 305 (1991)
- 27) 三好 秋馬ら : Progress in Medicine 11 1326 (1991)
- 28) 佐藤 信純ら : Progress in Medicine 11 714 (1991)
- 29) 土屋 雅春ら : 新藥と臨牀 40 498 (1991)
- 30) 三好 秋馬ら : 診斷と治療 82 1203 (1994)
- 31) 三好 秋馬ら : Progress in Medicine 14 1969 (1994)
- 32) 三好 秋馬ら : 診斷と治療 82 2193 (1994)
- 33) 川野 淳ら : Progress in Medicine 14 2014 (1994)

“약국 등의 개설자에 한하여 사용기한이 경과되었거나 변질·변패, 오손된 의약품 또는 부작용 등은 본사 마케팅부(수신자 부담 : 080-555-7171)에서 상담 및 교환, 교환에 드립니다. 그리고 제조과정과 관련된 제품의 품질에 대한 문의사항은 책임공장 품질경영본부(전화:080-333-6312)로 연락바랍니다.”

작성일 : 2008. 5. 28.
GT-B-0000-15-05

“이 첨부문서 작성일자 이후 변경된 내용은 당사 홈페이지(www.jeilpharm.co.kr)에서 확인하실 수 있습니다.”

소분판매원



제일약품 주식회사

본사 : 서울특별시 서초구 반포동 745-5
공장 : 경기도 용인시 처인구 백암면 근곡리 117-1



Manufactured by
TANABE SEIYAKU CO., LTD.

본사 : 2-10, Doshomachi, 3-Chome, Chuo-Ku, Osaka, 541 JAPAN
공장 : 7473-2, Oazazonoda, Onoda-City, Yamaguchi, 756 JAPAN