

気道粘液調整・粘膜正常化剤

** 日本薬局方 L-カルボシステイン錠

* **カルボシステイン錠250mg「サワイ」**

* **カルボシステイン錠500mg「サワイ」**

CARBOCISTEINE

日本標準商品分類番号

8 7 2 2 3 3

	錠250mg	錠500mg
* 承認番号	22400AMX00106000	22400AMX00107000
薬価収載	2013年6月	2013年6月
販売開始	1990年7月	2010年5月

貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示

【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】

組成

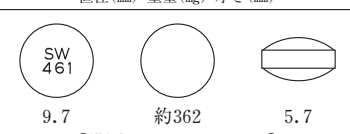

カルボシステイン錠250mg「サワイ」：1錠中に日局L-カルボシステイン250mgを含有する。

添加物として、カルナウバロウ、カルメロースCa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、硬化油、サラシミツロウ、酸化チタン、ステアリン酸Mg、D-ソルビトール、タルク、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000を含有する。

カルボシステイン錠500mg「サワイ」：1錠中に日局L-カルボシステイン500mgを含有する。

添加物として、カルナウバロウ、クロスカルメロースNa、ショ糖脂肪酸エステル、ステアリン酸Mg、タルク、ヒプロメロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)を含有する。

製剤の性状

品名	剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
カルボシステイン錠250mg「サワイ」	フィルムコーティング錠	 9.7 約362 5.7 [識別コード：SW 461]	白色
カルボシステイン錠500mg「サワイ」	割線入りフィルムコーティング錠	 6.9×15.1 約551 5.8 [識別コード：SW 123]	白色

【効能・効果】

下記疾患の去痰

上気道炎(咽頭炎、喉頭炎)、急性気管支炎、気管支喘息、慢性気管支炎、気管支拡張症、肺結核

慢性副鼻腔炎の排膿

【用法・用量】

カルボシステインとして、通常成人1回500mgを1日3回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 肝障害のある患者〔肝機能障害のある患者に投与した時、肝機能が悪化することがある。〕
- 心障害のある患者〔類薬で心不全のある患者に悪影響を及ぼしたとの報告がある。〕

2. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

1) 重大な副作用(頻度不明)

- 皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、中毒性表皮壊死症(Lyell症候群)**：皮膚粘膜眼症候群、中毒性表皮壊死症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状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。
- 肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、LDHの上昇等を伴う肝機能障害や黄疸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し、適切な処置を行うこと。
- ショック、アナフィラキシー様症状**：ショック、アナフィラキシー様症状(呼吸困難、浮腫、蕁麻疹等)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し、適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

	頻度不明
消化器	食欲不振、下痢、腹痛、悪心、嘔吐、腹部膨満感、口渇等
過敏症 ^{注)}	発疹、湿疹、紅斑、浮腫、発熱、呼吸困難等
その他	痒痒感

注)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投与しないことが望ましい。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

5. 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. 生物学的同等性試験

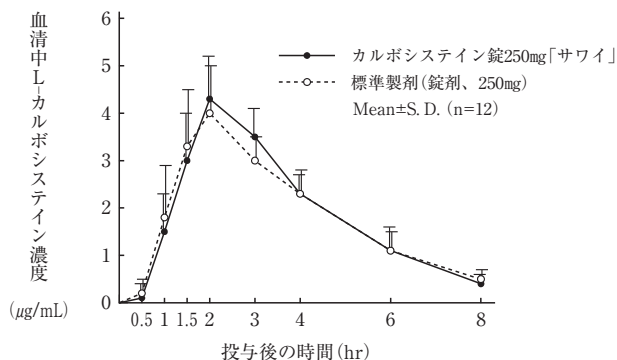
○カルボシステイン錠250mg「サワイ」

カルボシステイン錠250mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ2錠(L-カルボシステインとして500mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血清中L-カルボシステイン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})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。¹⁾

各製剤 2錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (μg/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} (μg·hr/mL)
カルボシステイン錠250mg「サワイ」	4.4±0.8	2.2±0.4	1.7±0.3	15.1±2.6
標準製剤 (錠剤、250mg)	4.2±1.0	2.0±0.5	1.8±0.3	14.7±2.5

(Mean ± S. D.)



血清中濃度ならびにAUC、C_{max}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。

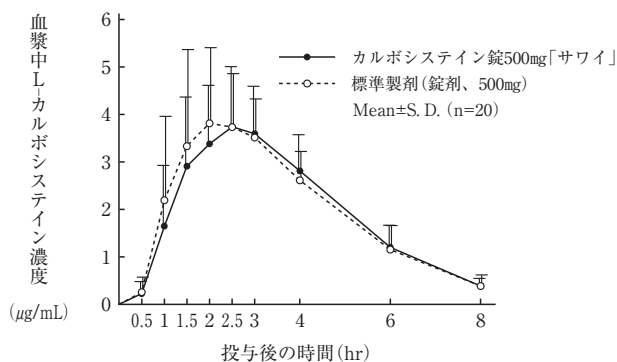
○カルボシステイン錠500mg「サワイ」

カルボシステイン錠500mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(L-カルボシステインとして500mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中L-カルボシステイン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})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。²⁾

各製剤 1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (μg/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} (μg·hr/mL)
カルボシステイン錠500mg「サワイ」	4.2±1.2	2.5±0.8	1.4±0.2	15.7±2.9
標準製剤 (錠剤、500mg)	4.4±1.2	2.5±1.2	1.4±0.4	15.9±2.8

(Mean ± S. D.)



血漿中濃度ならびにAUC、C_{max}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。

2. 溶出挙動

本製剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

カルボシステインは喀痰中のシアル酸とフコスの構成比を正常化し、また、障害された粘膜上皮の線毛細胞の修復を促進することにより、粘液線毛輸送能を改善する。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：L-カルボシステイン(L-Carbocysteine)

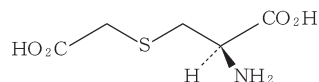
化学名：(2R)-2-Amino-3-carboxymethylsulfanylpropanoic acid

分子式：C₅H₉NO₄S

分子量：179.19

融点：約186℃(分解)

構造式：



性状：L-カルボシステインは白色の結晶性の粉末で、においはなく、わずかに酸味がある。水に極めて溶けにくく、エタノール(95)にほとんど溶けない。希塩酸又は水酸化ナトリウム試液に溶ける。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

錠250mg：PTP包装及びバラ包装したものを用いた長期保存試験(室温、5年間)の結果、通常の市場流通下において5年間安定であることが確認された。³⁾

錠500mg：PTP包装及びバラ包装したものを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。⁴⁾

【包装】

カルボシステイン錠250mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

バラ：1,000錠

カルボシステイン錠500mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)、210錠(21錠×10)、500錠(10錠×50)

バラ：200錠

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

1)、2) 沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験]

3)、4) 沢井製薬(株)社内資料[安定性試験]

・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター

〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30

TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

製造販売元

沢井製薬株式会社

大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K12 A160937