

** 2018年2月改訂(第9版)
* 2017年2月改訂

日本標準商品分類番号
872233

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「TCK」

** カルボシステイン錠500mg「TCK」

C A R B O C I S T E I N E

貯法：室温保存
使用期限：外装に表示

	錠 250mg	錠 500mg
** 承認番号	23000AMX00104000	23000AMX00105000
** 薬価収載	2018年6月	2018年6月
販売開始	2002年7月	2010年11月

【 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 】

カルボシステイン錠 250mg 「TCK」 は 1 錠中に L-カルボシステイン (日局) を 250mg 含有する。

添加物として、乳糖水和物、ポビドン、マクロゴール、ヒプロメロース、クロスカルメロース Na、ステアリン酸 Mg、デンプン、グリコール酸 Na、酸化チタン、カルナウバロウを含有する。

カルボシステイン錠 500mg 「TCK」 は 1 錠中に L-カルボシステイン (日局) を 500mg 含有する。

添加物として、クロスカルメロース Na、メタケイ酸アルミン酸 Mg、ポリビニルアルコール (部分けん化物)、ステアリン酸 Mg、ヒドロキシプロピルセルロース、マクロゴール、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、カルナウバロウを含有する。

販売名	外形			色調 剤形	識別コード
	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)		
カルボシステイン錠 250mg 「TCK」	 8.7	 5.4	 335	白色フィルムコーティング錠	TU-KR 250
カルボシステイン錠 500mg 「TCK」	 15.0×6.5	 6.0	 560	白色フィルムコーティング錠 (割線入り)	TU KR

【 効能又は効果 】

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

【 用法及び用量 】

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)

- (1) 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。]
- (2) 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)

- 1) 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。
- 2) 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。

3) 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。)

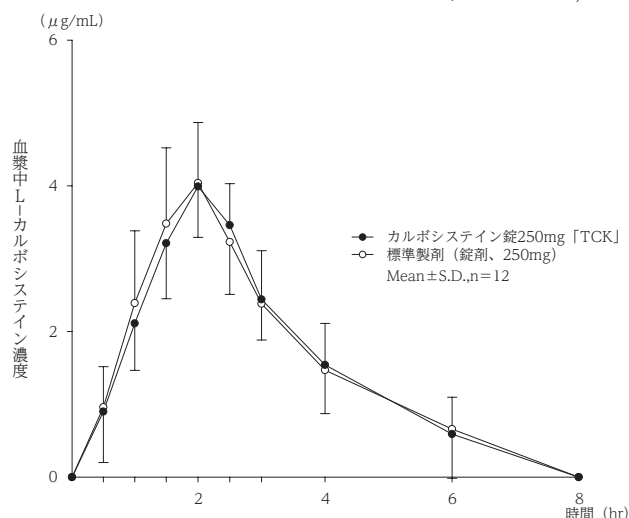
** 【 薬物動態 】

生物学的同等性試験

カルボシステイン錠 250mg 「TCK」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 2 錠 (L-カルボシステイン 500mg) 健康成人に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について 95% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、±20% の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0-8hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
カルボシステイン錠 250mg 「TCK」	12.15±2.17	4.21±0.48	2.08±0.29	2.07±1.61
標準製剤 (錠剤、250mg)	12.36±1.84	4.34±0.65	2.00±0.30	1.85±0.85

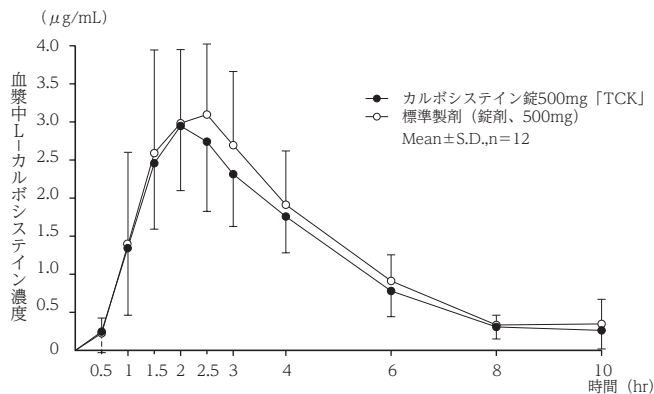
(Mean±S.D.,n=12)



カルボシステイン錠 500mg「TCK」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠 (L-カルボシステイン 500mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log (0.80) ~ log (1.25) の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0-10hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
カルボシステイン錠 500mg「TCK」	11.69±2.76	3.20±0.85	2.08±0.56	2.00±0.78
標準製剤 (錠剤、500mg)	12.87±3.71	3.48±0.99	2.17±0.54	1.96±0.52

(Mean±S.D.,n=12)



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。

溶出挙動

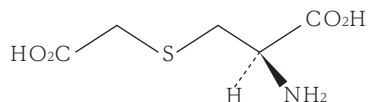
カルボシステイン錠 250mg「TCK」及びカルボシステイン錠 500mg「TCK」は、日本薬局方医薬品各条に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。²⁾

*【 薬効薬理 】

気道での作用は慢性気道疾患患者の喀痰中のシアル酸とフコースの構成比の正常化作用 (粘液成分の調整)、慢性気管支炎患者の気管支粘膜上皮の繊毛細胞の修復促進作用 (粘膜正常化)、副鼻腔での作用として慢性副鼻腔炎患者の鼻粘膜粘液繊毛輸送機能低下の改善作用、副鼻腔粘膜障害修復作用を示す。³⁾

【 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-Carbocisteine)
 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：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

加速試験 (40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月) の結果、カルボシステイン錠 250mg「TCK」及びカルボシステイン錠 500mg「TCK」は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「TCK」：100錠 (PTP) 1,000錠 (PTP)
 カルボシステイン錠 500mg「TCK」：100錠 (PTP) 1,000錠 (PTP)

*【 主要文献 】

- 1) 辰巳化学株式会社：生物学的同等性試験
- 2) 辰巳化学株式会社：溶出試験
- 3) 第十七改正 日本薬局方解説書
- 4) 辰巳化学株式会社：安定性試験

【 文献請求先 】

主要文献に記載の社内資料につきましては下記にご請求下さい。
 辰巳化学株式会社 薬事・学術課
 〒 921-8164 金沢市久安3丁目 406 番地
 TEL 076-247-2132
 FAX 076-247-5740



製造販売元
辰巳化学株式会社
 金沢市久安3丁目406番地