

※※印：2016年10月改訂(第13版、社名変更等に伴う改訂)
※印：2013年12月改訂

日本標準商品分類番号
872233

貯 法：●室温保存
●使用後密栓して保存すること。
使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。

※ 承認番号	22500AMX01355000
※ 薬価 収載	2013年12月
販売開始	1990年 7月
効能追加	1991年 6月

気道粘液調整・粘膜正常化剤

※カルボシステインシロップ小児用5%「TEVA」

Carbocisteine Syrup for Pediatric 5% "TEVA"

カルボシステインシロップ

【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	1mL中：L-カルボシステイン ……50mg (添加物) カラメル、精製白糖、ソルビン酸、pH調節剤、香料
性 状	特異な芳香及び甘味を有する褐色のシロップ剤
pH	5.5~7.5

【効能・効果】

- 下記疾患の去痰
上気道炎(咽喉炎、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
- 滲出性中耳炎の排水

【用法・用量】

通常、幼・小児に、体重kg当り、カルボシステインとして1日30mg(本剤0.6mL)を3回に分割して経口投与する。
なお、年齢、体重、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)、ALP、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	そう痒感

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。

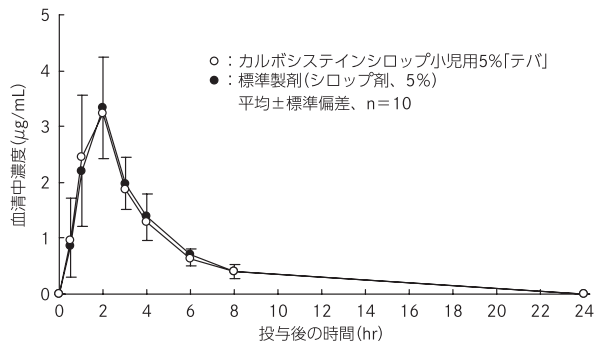
4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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]

【薬物動態】¹⁾

生物学的同等性試験

カルボシステインシロップ小児用5%「TEVA」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ10mL(L-カルボシステインとして500mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血清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。(対象適用外)



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=10)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₂₄ (µg·hr/mL)	Cmax (µg/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
カルボシステインシロップ小児用5%「TEVA」	500	14.17 ± 1.98	3.68 ± 0.70	1.8 ± 0.4	2.48 ± 0.84
標準製剤(シロップ剤、5%)	500	14.60 ± 1.61	3.62 ± 0.66	1.8 ± 0.4	2.57 ± 1.03

血清中濃度並びに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。

【薬効薬理】²⁾

カルボシステインは、気道粘液構成成分の組成を正常化することにより粘液粘度を低下させ去痰作用を示すとともに、気道粘膜の病的組織変化に対する修復作用を示す。

1. 粘液構成成分正常化作用

(1) カルボシステイン(500~2,000mg/kg, p.o.)は、亜硫酸ガス吸入法により惹起した慢性気管支炎ウサギの気道粘液粘度を低下させ、また、粘液分泌量には影響を及ぼさず粘液乾燥物質重量、たん白質量及び糖質質量を用量依存かつ有意に減少させ、気道粘液構成成分の正常化作用を示すことが認められた。

(2) カルボシステイン(10⁻⁶~10⁻⁴M)は、イヌ摘出気管の酸性及び中性糖たん白含有腺房細胞数には影響を及ぼさず硫酸化糖たん白高含有腺房細胞数を有意に減少させ、粘性因子である酸性糖たん白含有腺房細胞の構成比を調整することにより気道粘液の性状を改善するものと考えられた。(in vitro)

2. 気管支粘膜修復作用

カルボシステイン(250mg/kg×2/day, 15days, p.o.)は、亜硫酸ガス吸入法により惹起した慢性気管支炎ラットの気管萎縮変性(線毛の短小化・集簇・消失、円柱上皮細胞の重層化及び粘液分泌細胞の減少)を明らかに抑制し、粘膜修復作用を示すことが認められた。

【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

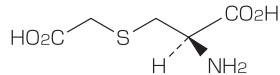
分子式：C₅H₉NO₄S

分子量：179.19

融点：約186℃(分解)

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。

構造式：



【取扱い上の注意】³⁾

安定性試験結果の概要

長期保存試験(2年)の結果、カルボシステインシロップ小児用5%「テバ」は通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された。

【包装】

カルボシステインシロップ小児用5%「テバ」
500mL

【主要文献】

- 1) 武田テバファーマ(株)社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 武田テバファーマ(株)社内資料(薬効薬理試験)
- 3) 武田テバファーマ(株)社内資料(安定性試験)

※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

武田テバファーマ株式会社 武田テバDIセンター
〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号
TEL 0120-923-093

受付時間 9:00~17:30(土日祝日・弊社休業日を除く)

※※販売

武田薬品工業株式会社
大阪市中央区道修町四丁目1番1号

※※製造販売元

武田テバファーマ株式会社
名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

PQMA0901