



\* 2016年7月改訂（第2版）  
2016年6月作成

日本標準商品分類番号  
872233

\* 貯 法：室温保存、気密容器  
使用期限：外箱等に表示  
注 意：「取扱い上の注意」の項参照

	錠250mg「JG」	錠500mg「JG」
承認番号	22800AMX 00164000	22800AMX 00165000
薬価収載	2016年6月	2016年6月
販売開始	2016年6月	2016年6月

### 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「JG」 カルボシステイン錠500mg「JG」

#### 【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】

販売名	カルボシステイン錠 250mg「JG」	カルボシステイン錠 500mg「JG」
成分・含量 (1錠中)	L-カルボシステイン 250.00mg	L-カルボシステイン 500.00mg
添加物	クロスカルメロースナトリウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、フマル酸ステアリルナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、カルナウバロウ	
色・剤形	白色、円形のフィルムコーティング錠	白色、楕円形の割線入りフィルムコーティング錠
外形		
大きさ (mm)	直径：8.7 厚さ：4.3	長径：15.9 短径：7.5 厚さ：5.2
重量 (mg)	281.20	559.00
本体表示	カルボシステイン 250 JG	カルボシステイン 500 JG

#### 【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（250mg錠の場合：本品2錠）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）、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 <sup>※</sup>	発疹、湿疹、紅斑等、浮腫、発熱、呼吸困難
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】

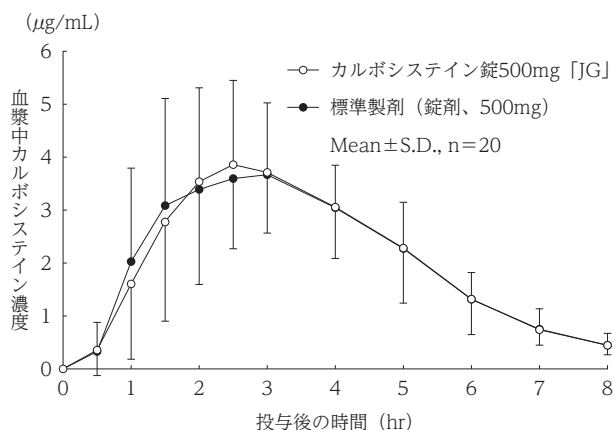
### 1. 生物学的同等性試験

#### (1) カルボシステイン錠250mg [JG]

カルボシステイン錠250mg [JG] は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号 別紙2）」に基づき、カルボシステイン錠500mg [JG] を標準製剤とした溶出試験の結果、溶出挙動は同等と判定され、生物学的に同等とみなされた。<sup>1)</sup>

#### (2) カルボシステイン錠500mg [JG]

カルボシステイン錠500mg [JG] と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（L-カルボシステインとして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、それぞれ $\log(0.9236) \sim \log(1.0440)$  及び  $\log(0.8714) \sim \log(1.0358)$  と、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>2)</sup>



### 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-8</sub> (μg·hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
カルボシステイン錠500mg [JG]	16.48 ± 3.34	4.61 ± 1.02	2.8 ± 1.0	1.3 ± 0.1
標準製剤 (錠剤, 500mg)	16.57 ± 2.18	4.78 ± 0.73	2.5 ± 1.1	1.3 ± 0.1

(Mean ± S.D., n = 20)

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。

### 2. 溶出挙動

カルボシステイン錠250mg [JG] 及びカルボシステイン錠500mg [JG] は、日本薬局方医薬品各条に定められたL-カルボシステイン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。<sup>3)</sup>

## 【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。<sup>4)</sup>

## 【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）

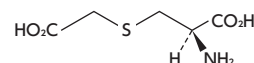
化学名：(2R)-2-Amino-

3-carboxymethylsulfanylpropanoic acid

分子式：C<sub>5</sub>H<sub>9</sub>NO<sub>4</sub>S

分子量：179.19

構造式：



性状：白色の結晶性の粉末で、においはなく、僅かに酸味がある。

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。

融点：約186℃（分解）

## 【取扱い上の注意】

### 安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、カルボシステイン錠250mg [JG] 及びカルボシステイン錠500mg [JG] 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。<sup>5)</sup>

### 【包装】

カルボシステイン錠250mg [JG]

PTP：100錠（10錠×10）、500錠（10錠×50）

バラ：500錠

カルボシステイン錠500mg [JG]

PTP：100錠（10錠×10）、500錠（10錠×50）

バラ：500錠

## 【主要文献及び文献請求先】

### 〈主要文献〉

- 1) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；生物学的同等性試験（2016）
- 2) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；生物学的同等性試験（2016）
- 3) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；溶出試験（2016）
- 4) 日本薬局方解説書、廣川書店
- 5) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；安定性試験（2016）

### 〈文献請求先・お問合せ先〉

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室  
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目9番1号  
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

製造販売元



日本ジェネリック株式会社

東京都千代田区丸の内一丁目9番1号