

貯 法：室温保存

使用期限：外箱等に表示(2年)

注 意：取扱上の注意の項参照

承認番号	22200AMX00682
薬価収載	2010年11月
販売開始	2010年11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5%「タカタ」

L-カルボシステインシロップ

CARBOCISTEINE



【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】

1. 組成

品 名	カルボシステインシロップ5%「タカタ」
成分・分量	1 mL中 L-カルボシステイン 50mg
添 加 物	D-ソルビトール液、ソルビン酸、サッカリンナトリウム水和物、水酸化ナトリウム、塩酸、カラメル、香料

2. 製剤の性状

品 名	カルボシステインシロップ5%「タカタ」
性 状	褐色の液で、特異な芳香があり、味は甘い。

【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

○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[頻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)、中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis : TEN) 皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)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、口渴等
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)症状があらわれた場合には、投与を中止すること。(太字)

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

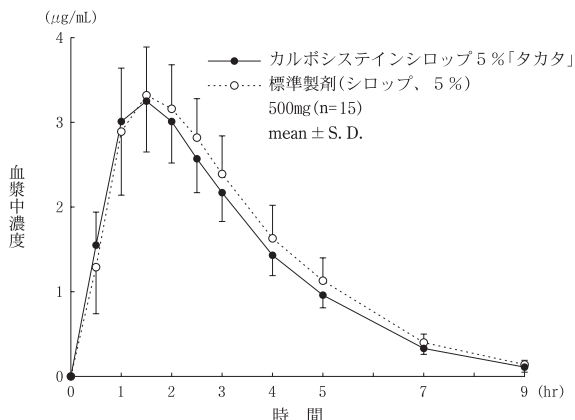
妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、投与しないことが望ましい。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

【薬物動態】

生物学的同等性試験¹⁾

本剤と標準製剤(シロップ、5%)をクロスオーバー法により、健康成人男子15名にそれぞれ10mL(L-カルボシステインとして500mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、5、7及び9時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MSにより測定したL-カルボシステインの血漿中濃

度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
カルボシステインシロップ5%「タカタ」	11.96 ± 1.61	3.26 ± 0.59	1.5 ± 0.2	1.4 ± 0.1
標準製剤(シロップ、5%)	12.80 ± 1.80	3.36 ± 0.58	1.5 ± 0.3	1.4 ± 0.1

(mean ± S. D.)

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。

【薬効薬理】

L-カルボシステインの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、中耳での作用は中耳腔貯留液排泄促進作用、粘膜正常化作用を示す。²⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

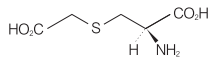
一般名：L-カルボシステイン[日局]

L-Carbocysteine

化学名：(2R)-2-Amino-3-

carboxymethylsulfanylpropanoic acid

構造式：



分子式：C₅H₉NO₄S

分子量：179.19

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)

旋光度：[α]_D²⁰：-33.5～-36.5° 本品を乾燥し、その約5gを精密に量り、水20mL及び水酸化ナトリウム溶液(13→100)に溶かし、1mol/L塩酸試液及び0.1mol/L塩酸試液を加え、pH6.0に調整した後、更に水を加えて正確に50mLとする。この液につき、層長100mmで測定する。

【取扱い上の注意】**

今回改訂
→

1. 貯法

開栓後は汚染防止のため、使用の都度必ず密栓し冷所に保存すること。

2. 安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、60%RH、24ヵ月)の結果、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5%「タカタ」

500mL(褐色ガラス瓶)

【主要文献】

- 1) 佐藤精一他：診療と新薬, 47(9)：861, 2010.
- 2) 日本薬局方解説書編集委員会編：第十七改正 日本薬局方解説書(廣川書店)C-1330, 2016.
- 3) 高田製薬(株)社内資料(安定性)

【文献請求先】*

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下さい。

前回改訂
⇒

高田製薬株式会社 学術部

〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

製造販売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1