

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

気道粘液調整・粘膜正常化剤
L-カルボシステインシロップ

カルボシステインシロップ5%「タカタ」

Carbocisteine Syrup “TAKATA”

剤形	シロップ剤	
製剤の規制区分	該当しない	
規格・含量	1mL 中 日局 L-カルボシステイン 50mg	
一般名	和名：L-カルボシステイン（JAN） 洋名：L-Carbocisteine（JAN）、carbocisteine（INN）	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日	2010 年 7 月 15 日
	薬価基準収載年月日	2010 年 11 月 19 日
	販売開始年月日	2010 年 11 月 19 日
製造販売（輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元：高田製薬株式会社	
医薬情報担当者 の連絡先		
問い合わせ窓口	高田製薬株式会社 TEL：0120-989-813 FAX：048-838-2121 医療関係者向けホームページ https://www.takata-seiyaku.co.jp	

本 IF は 2023 年 6 月改訂（第 1 版）の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の電子添文等の情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

また、専用アプリ「添文ナビ®」（®：登録商標）で以下の GS1 バーコードを読み取ることで同様の情報を閲覧できます。



(01)14987120223706

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

－日本病院薬剤師会－

(2020 年 4 月改訂)

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IF と略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第 2 小委員会が IF の位置付け、IF 記載様式、IF 記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第 3 小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会が IF 記載要領の改訂を行ってきた。

IF 記載要領 2008 以降、IF は PDF 等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加した IF が速やかに提供されることとなった。最新版の IF は、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品の IF の情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF 記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IF に記載する項目配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IF の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IF の利用にあたって

電子媒体の IF は、PMDA の医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って IF を作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XⅡ. 参考資料」、「XⅢ. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IF は日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR 等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らが IF の内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IF を活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯…………… 1
2. 製品の治療学的特性…………… 1
3. 製品の製剤学的特性…………… 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性…………… 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項…………… 1
6. RMP の概要…………… 1

II. 名称に関する項目

1. 販売名…………… 2
2. 一般名…………… 2
3. 構造式又は示性式…………… 2
4. 分子式及び分子量…………… 2
5. 化学名(命名法)又は本質…………… 2
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号…………… 2

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質…………… 3
2. 有効成分の各種条件下における安定性…………… 3
3. 有効成分の確認試験法, 定量法…………… 3

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形…………… 4
2. 製剤の組成…………… 4
3. 添付溶解液の組成及び容量…………… 4
4. 力価…………… 4
5. 混入する可能性のある夾雑物…………… 5
6. 製剤の各種条件下における安定性…………… 5
7. 調製法及び溶解後の安定性…………… 7
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)…………… 7
9. 溶出性…………… 7
10. 容器・包装…………… 8
11. 別途提供される資材類…………… 8
12. その他…………… 8

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果…………… 9
2. 効能又は効果に関連する注意…………… 9
3. 用法及び用量…………… 9
4. 用法及び用量に関連する注意…………… 9
5. 臨床成績…………… 9

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群…………… 12
2. 薬理作用…………… 12

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移…………… 14
2. 薬物速度論的パラメータ…………… 15
3. 母集団(ポピュレーション)解析…………… 15
4. 吸収…………… 15
5. 分布…………… 16
6. 代謝…………… 16
7. 排泄…………… 16
8. トランスポーターに関する情報…………… 16

9. 透析等による除去率…………… 17
10. 特定の背景を有する患者…………… 17
11. その他…………… 17

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

1. 警告内容とその理由…………… 18
2. 禁忌内容とその理由…………… 18
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由…………… 18
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由…………… 18
5. 重要な基本的注意とその理由…………… 18
6. 特定の背景を有する患者に関する注意…………… 18
7. 相互作用…………… 19
8. 副作用…………… 19
9. 臨床検査結果に及ぼす影響…………… 20
10. 過量投与…………… 20
11. 適用上の注意…………… 20
12. その他の注意…………… 20

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験…………… 21
2. 毒性試験…………… 21

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分…………… 22
2. 有効期間…………… 22
3. 包装状態での貯法…………… 22
4. 取扱い上の注意…………… 22
5. 患者向け資材…………… 22
6. 同一成分・同効薬…………… 22
7. 国際誕生年月日…………… 22
8. 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価基準
収載年月日, 販売開始年月日…………… 22
9. 効能又は効果追加, 用法及び用量変更追加等
の年月日及びその内容…………… 22
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその
内容…………… 22
11. 再審査期間…………… 23
12. 投薬期間制限に関する情報…………… 23
13. 各種コード…………… 23
14. 保険給付上の注意…………… 23

X I. 文献

1. 引用文献…………… 24
2. その他の参考文献…………… 24

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況…………… 25
2. 海外における臨床支援情報…………… 25

X III. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うに
あたっての参考情報…………… 26
2. その他の関連資料…………… 26

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

カルボシステインシロップ 5%「タカタ」は高田製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2010 年 7 月に承認を取得した。

2. 製品の治療学的特性

効能・効果として以下の適応がある。（「V. 1. 効能又は効果」の項参照）

○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

○滲出性中耳炎の排液

重大な副作用として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）、肝機能障害、黄疸、ショック、アナフィラキシーが報告されている。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

原薬の酸味を抑えることを考慮したチョコバナナ風味のシロップ
（「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照）

4. 適正使用に関して周知すべき特性

該当しない

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

カルボシステインシロップ 5% 「タカタ」

(2) 洋名

Carbocysteine Syrup 5% “TAKATA”

(3) 名称の由来

一般名による

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

L-カルボシステイン（JAN）

(2) 洋名（命名法）

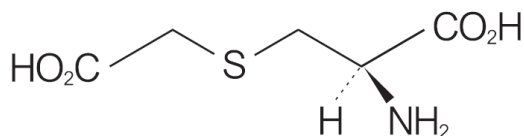
L-Carbocysteine（JAN）

carbocysteine（INN）

(3) ステム (stem)

粘液溶解薬（ブロムヘキシン誘導体以外）：-steine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₅H₉NO₄S

分子量：179.19

5. 化学名（命名法）又は本質

(2*R*)-2-Amino-3-carboxymethylsulfanylpropanoic acid

6. 慣用名，別名，略号，記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・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。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点），沸点，凝固点

融点：約 186℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

旋光度： $[\alpha]_{\text{D}}^{20}$ ：-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。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法，定量法

確認試験法

日局「L-カルボシステイン」の確認試験による。

定量法

日局「L-カルボシステイン」の定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

シロップ剤

(2) 製剤の外観及び性状

褐色の液で、特異な芳香があり、味は甘い。

香料によりチョコバナナ風味を付けている。

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

有効成分	添加剤
1mL 中 日局 L-カルボシステイン 50mg	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) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

(1) 長期保存試験

下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(3 ロット)

	開始時	3 ヶ月	6 ヶ月	12 ヶ月	24 ヶ月
性状	褐色の液で、特異な芳香があり、味は甘かった。				
pH	6.47-6.53	6.40-6.45	6.37-6.42	6.39-6.44	6.36-6.41
残存率(%)	100	98.2-98.7	97.5-98.6	98.0-98.2	96.0-96.6

(2) 苛酷試験(参考)

表 2 温度(50℃±1℃、褐色ガラス瓶)

(1 ロット)

試験項目	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性 状	褐色の液で、特異な芳香があり、味は甘い。			
pH	6.39	6.27	6.26	6.25
残存率(%)	100	98.8	95.1	91.4

経時的に含量が低下し、3 ヶ月後には 8.6%残存率が低下していることから、長期間の熱の影響を避け、取り扱いに注意する必要があると考えられた。

表 3 光(昼光色蛍光ランプ、約 6500 lx、褐色ガラス瓶)

(1 ロット)

試験項目	開始時	15 日後	30 日後
性 状	褐色の液で、特異な芳香があり、味は甘い。		
pH	6.39	6.26	6.31
残存率(%)	100	101.5	100.8

(3) 開封後の安定性試験

カルボシステインシロップ 5%「タカタ」の開封後、冷所保存での安定性を評価した結果、少なくとも 5℃の条件下で 24 箇月は規格内であることが確認された。

また、室温保存での安定性は、純度試験で類縁物質が経時的に増加し、定量値が経時的に低下したが、規格内であった。また他の項目で経時的变化が認められず、規格内であった。

これより、開封後、室温保存で 24 箇月は規格内であったが、経時的に類縁物質が増加し、定量値が低下することから、冷所に保存すること。

表 4 保存条件 5℃

試験項目	判定基準	試験 開始時	6 箇月後	12 箇月	18 箇月	24 箇月
性状	褐色の液で、 特異な芳香があり、 味は甘かった	褐色の液で、特異な芳香があり、味は甘かった				
pH	5.5～7.5	6.6	6.6	6.6	6.6	6.6
純度試験 (類縁物質)	2.0%以下	0.05	0.15	0.13	0.18	0.22
菌数限度試験 (生菌数)	総好気性微生物数 100cfu/mL 未満	0	0	0	0	0
	総真菌数 10cfu/mL 未満	0	0	0	0	0
菌数限度試験 (特定微生物)	大腸菌は認めない	適	適	適	適	適
	黄色ブドウ球菌は 認めない	適	適	適	適	適
	緑膿菌は認めない	適	適	適	適	適
	サルモネラ菌は 認めない	適	適	適	適	適
定量	95～105%	100.03	99.02	98.63	99.38	99.37

表 5 保存条件 25℃

試験項目	判定基準	試験 開始時	6 箇月後	12 箇月	18 箇月	24 箇月
性状	褐色の液で、 特異な芳香があり、 味は甘かった	褐色の液で、特異な芳香があり、味は甘かった				
pH	5.5～7.5	6.49	6.50	6.38	6.46	6.31
純度試験 (類縁物質)	2.0%以下	0.06	0.56	0.99	1.34	1.96
菌数限度試験 (生菌数)	総好気性微生物数 100cfu/mL 未満	0	0	0	0	0
	総真菌数 10cfu/mL 未満	0	0	0	0	0
菌数限度試験 (特定微生物)	大腸菌は認めない	適	適	適	適	適
	黄色ブドウ球菌は 認めない	適	適	適	適	適
	緑膿菌は認めない	適	適	適	適	適
	サルモネラ菌は 認めない	適	適	適	適	適
定量	95～105%	99.64	99.40	97.31	97.44	96.64

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

別紙 配合変化表を参照

9. 溶出性

該当資料なし

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装, 外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

500mL [褐色ガラス瓶]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

瓶	容器：褐色ガラス 中栓：ポリエチレン キャップ：ポリプロピレン 個装箱：紙
---	--

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 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

○滲出性中耳炎の排液

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

通常、幼・小児に、体重 kg 当り、L-カルボシステインとして 1 日 30mg 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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈急性気管支炎及び気管支喘息の去痰〉

17.1.1 国内プラセボ対照二重盲検比較試験

咳、痰を伴う気管支喘息、急性気管支炎などの小児呼吸器疾患患者を対象に、カルボシステインシロップ 2%（カルボシステインとして 30mg/kg/日）又はプラセボを 7 日間投与する二重盲検比較試験を実施した。解析対象集団 140 例での軽度改善以上を有効とした有効率は、カルボシステイン群 80.6%（54/67 例）、プラセボ群 63.0%（46/73 例）であり、カルボシステイン群はプラセボ群と比べて有意に改善した（ $p<0.05$ ）。また、痰の切れの難易度及び喘鳴に対し、カルボシステイン群はプラセボ群に比べ有意に改善した（ $p<0.05$ ）。

カルボシステイン群で副作用は認められなかった²⁾。

〈慢性副鼻腔炎の排膿〉

17.1.2 国内実薬対照二重盲検比較試験

慢性副鼻腔炎患者を対象に、カルボシステイン又は実薬対照である L-システインエチル塩酸塩を 4 週間投与する二重盲検比較試験を実施した。解析対象集団 242 例での全般改善度は下表のとおりであり、カルボシステインの有用性が認められている。カルボシステイン群の副作用発現頻度は 1.5%（2/134 例）、嘔吐 1 例、口渇感 1 例であった³⁾。

表 17-1 全般改善度

薬剤		改善率	
		カルボシステイン	L-システインエチル塩酸塩
評価項目	著明改善	20.2% [#] (25/124 例)	6.8% (8/118 例)
	中等度改善以上	53.2% [#] (66/124 例)	32.2% (38/118 例)
	軽度改善以上	91.1% (113/124 例)	84.7% (100/118 例)

$p<0.01$

〈滲出性中耳炎の排液〉

17.1.3 国内プラセボ対照二重盲検比較試験

小児滲出性中耳炎患者を対象に、カルボシステインシロップ 5%又はプラセボを 4 週間投与する二重盲検比較試験を実施した。解析対象集団 214 例での軽度改善以上の改善率は、カルボシステイン群 79.8%（83/104 例）、プラセボ群 58.2%（64/110 例）であり、カルボシステイン群はプラセボ群と比べて有意に改善した（ $p<0.01$ ）。また、貯留液の量、性状、標準純音聴力及びティンパノグラムに対し、カルボシステイン群はプラセボ群と比べて有意に改善した（ $p<0.05$ ）。

副作用発現頻度はカルボシステイン群 2.5%（3/121 例）、プラセボ群 1.6%（2/122 例）であった。カルボシステイン群で認められた副作用は、嘔吐 2 例、湿疹 1 例であった⁴⁾。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

- 1) 使用成績調査（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

- 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

喀痰粘度低下作用⁵⁾

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

カルボシステインは、粘液の調整作用及び粘膜の正常化作用により粘液線毛輸送能を改善し、喀痰、鼻汁、中耳貯留液の排泄を促進する⁶⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18. 薬効薬理

〈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、気管支拡張症及び肺結核の去痰〉

18.2 粘液構成成分調整作用

慢性気道疾患患者の喀痰中のシアル酸、フコースの構成比を正常化した⁷⁾。
亜硫酸ガス曝露により変化するシアル酸/フコース分解酵素及びシアル酸/フコース合成酵素活性を正常化した。同時に、その分泌粘液の主成分であるムチン（Muc-5ac タンパク質）生成の増加を抑制した（ラット）⁸⁾。

18.3 杯細胞過形成抑制作用

慢性気道疾患患者の組織学的検査において気道粘膜の杯細胞過形成を抑制した（外国人データ）⁹⁾。
亜硫酸ガス曝露モデルにおいて気道の杯細胞過形成を抑制した（ラット）¹⁰⁾。

18.4 気道炎症抑制作用

亜硫酸ガス曝露により増加する気道への炎症細胞浸潤（数）、活性酸素量及びエラスターゼ活性を抑制した（ラット）^{10,11)}。
fMLP により刺激したヒト好中球の活性化を抑制した（*in vitro*）¹²⁾。

18.5 粘膜正常化作用

慢性気管支炎患者の気管支粘膜上皮の線毛細胞の修復を促進した¹³⁾。

〈慢性副鼻腔炎の排膿〉

18.6 粘液線毛輸送能改善作用

慢性副鼻腔炎患者で、低下した鼻粘膜粘液線毛輸送能を改善した¹⁴⁾。

18.7 粘膜正常化作用

エンドトキシン注入あるいは亜硫酸ガス曝露による副鼻腔粘膜の障害を軽減し、修復を促進した（ウサギ）^{15,16)}。

〈滲出性中耳炎の排液〉

18.8 粘液線毛輸送能改善作用

滲出性中耳炎患者で耳管の粘液線毛輸送能を改善した¹⁷⁾。

18.9 粘膜正常化作用

亜硫酸ガス（ウサギ）あるいは二酸化窒素（モルモット）曝露による中耳粘膜の障

害を軽減し、更に粘膜の修復を促進した^{18,19)}。

18.10 中耳貯留液排泄促進作用

亜硫酸ガス（ウサギ）あるいは二酸化窒素（モルモット）曝露による実験的滲出性
中耳炎病態モデルにおいて、中耳腔貯留液の排泄を促進した^{18,19)}。

18.11 炎症抑制作用

滲出性中耳炎モデルにおいて好中球の活性酸素産生能を抑制した（モルモット）²⁰⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

カルボシステインシロップ 5%「タカタ」とムコダインシロップ 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²¹⁾。

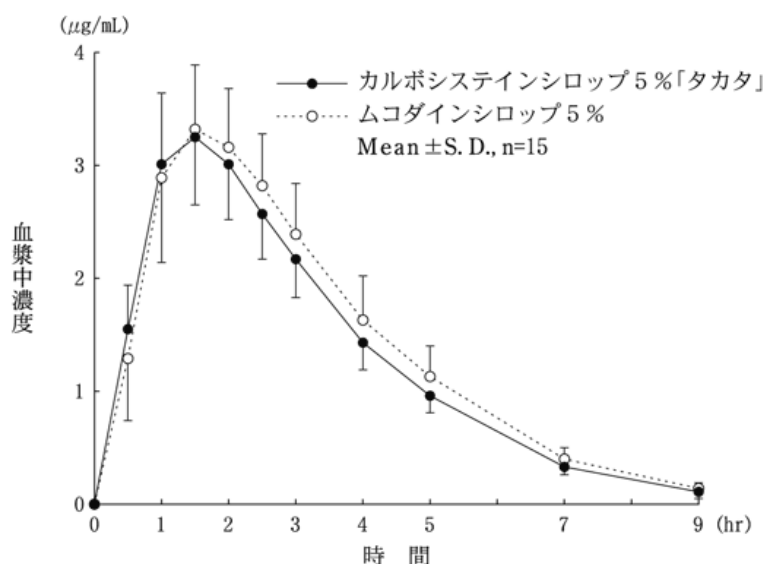


図 16-1 血漿中濃度

表 16-1 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (μg・hr/mL)	C _{max} (μg/mL)	t _{max} (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
ムコダイン シロップ5%	12.80±1.80	3.36±0.58	1.5±0.3	1.4±0.1

(Mean ± S. D., n=15)

血漿中濃度並びに 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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数²¹⁾

	消失速度定数 $[k_{el} (hr^{-1})]$
カルボシステインシロップ 5%「タカタ」	0.50623 ± 0.03860 (n=15)

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種, 寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比, 存在比率

該当資料なし

7. 排泄

該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

「Ⅷ. 6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 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

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

肝機能が悪化することがある。[11.1.2 参照]

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 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）（いずれも頻度不明）

11.1.2 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

AST、ALT、Al-P、LDH の上昇等があらわれることがある。[9.3 参照]

11.1.3 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

呼吸困難、浮腫、蕁麻疹等があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満 ^{注)}	0.1%未満 ^{注)}	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	
過敏症	発疹	湿疹、紅斑	浮腫、発熱、呼吸困難
その他		そう痒感	

注) ムコダイン錠 250mg、錠 500mg、細粒、K10、シロップ 2%、シロップ 5%、DS を合わせた集計である。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

設定されていない

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：該当しない

有効成分：該当しない

2. 有効期間

2 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

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。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：ムコダイン錠 250mg・500mg/DS50%/シロップ 5%

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日

履歴	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始年月日
—	2010 年 7 月 15 日	22200AMX00682	2010 年 11 月 19 日	2010 年 11 月 19 日

9. 効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、厚生労働省告示第 97 号(平成 20 年 3 月 19 日付)に基づく「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価 基準収載医薬品 コード	個別医薬品 コード (YJ コード)	HOT(9 桁)番号	レセプト電算 処理システム用 コード
カルボシステイン シロップ 5% 「タカタ」	2233002Q1019	2233002Q1108	120049201	622004901

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 社内資料：安定性試験（カルボシステインシロップ 5%「タカタ」）
- 2) 中山喜弘他：小児科臨床 1977；30（10）：1823-1830
- 3) 馬場駿吉他：耳鼻と臨床 1988；34（1）：33-47
- 4) 熊沢忠躬他：耳鼻咽喉科展望 1987；30（6）：719-735
- 5) 薬剤分類情報閲覧システム
<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>（2025/12/16 アクセス）
- 6) 日本薬局方解説書編集委員会編：第十八改正 日本薬局方解説書 2021；C-1415-1418
- 7) 安岡劭他：気管支学 1986；8（3）：312-320
- 8) Ishibashi, Y. et al. :Eur. J. Pharmacol. 2004；487：7-15
- 9) Miskovits, G. et al. :Forum. Ser. R. Soc. Med. 1982；5：1-3
- 10) Sueyoshi, S. et al. :Int. Arch. Allergy Immunol. 2004；134：273-280
- 11) 石橋祐二他：日本呼吸器学会雑誌 2001；39：17-23
- 12) Ishii, Y. et al. :Eur. J. Pharmacol. 2002；449：183-189
- 13) 萩原正雄他：気管支学 1982；4（3）：235-244
- 14) 間島雄一他：耳鼻臨床 1987；80：1313-1319
- 15) 前山拓夫他：耳鼻咽喉科展望 1986；29：447-457
- 16) 大橋淑宏他：日本耳鼻咽喉科学会会報 1985；88：1056-1060
- 17) 三谷幸恵他：耳鼻咽喉科展望 1996；39：69-76
- 18) 大橋淑宏他：日本耳鼻咽喉科学会会報 1985；88：1051-1055
- 19) 大橋淑宏他：日本耳鼻咽喉科学会会報 1988；91：71-87
- 20) 太神尚士他：耳鼻咽喉科免疫アレルギー2001；19：158-159
- 21) 社内資料：生物学的同等性試験（カルボシステインシロップ 5%「タカタ」）

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XⅢ. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

高田製薬株式会社 医療関係者向けサイト

<https://www.takata-seiyaku.co.jp/medical/>

MEMO

製造販売元

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1