

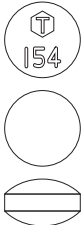
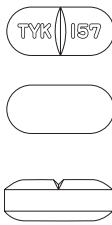
気道粘液調整・粘膜正常化剤
** 日本薬局方 L-カルボシステイン錠
シスダイン[®]錠 250mg
シスダイン[®]錠 500mg
CISDYNE[®] Tab. 250mg・500mg

貯 法：室温保存
使用期限：3年（外箱、ラベルに表示）

	錠250mg	錠500mg
承認番号	21800AMX10768	22200AMX00502
薬価収載	2006年12月	2010年11月
販売開始	1990年7月	2010年11月
効能追加	1991年6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】

販売名	シスダイン錠250mg	シスダイン錠500mg
有効成分	日局 L-カルボシステイン	
含量（1錠中）	250mg	500mg
添加物	乳糖水和物、ポビドン、デンプン、グリコール酸ナトリウム、クロスカルメロースナトリウム、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、酸化チタン、カルナウバロウ	クロスカルメロースナトリウム、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、ステアリン酸マグネシウム、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、カルナウバロウ
性状	白色のフィルムコーティング錠	割線入り白色のフィルムコーティング錠
外形		
大きさ	直径：8.7mm 厚み：5.4mm 質量：約335mg	長径：15.0mm 短径：6.5mm 厚み：6.0mm 質量：約550mg
識別コード	本体：154 PTP：TYK154	本体・PTP：TYK157

【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（本品2錠又は1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)、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	掻痒感

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、更には穿孔を起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⁾

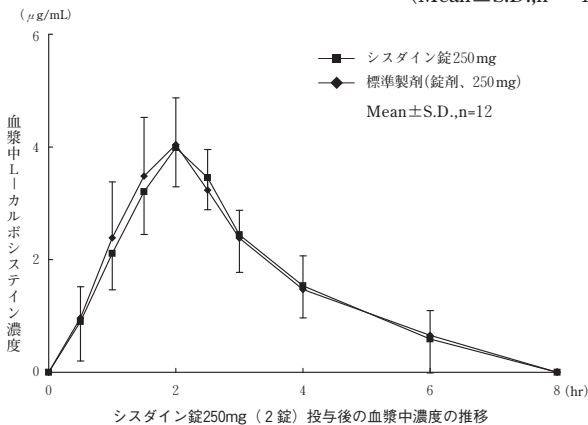
シスダイン錠250mg及びシスダイン錠500mgと標準製剤をクロスオーバー法により、それぞれ2錠又は1錠（カルボシステインとして500mg）を健康成人に空腹時

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。

○シスダイニン錠250mg

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₈ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)	Cmax ($\mu\text{g/mL}$)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
シスダイニン錠 250mg	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)

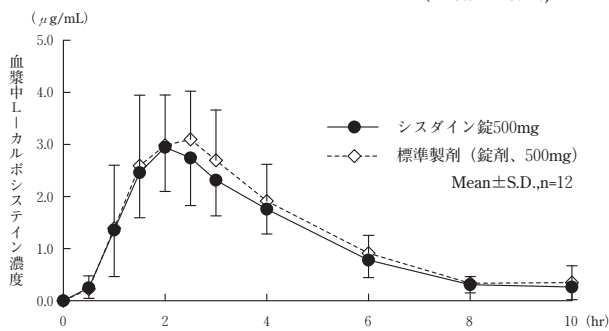


シスダイニン錠250mg (2錠) 投与後の血漿中濃度の推移

○シスダイニン錠500mg

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₀ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)	Cmax ($\mu\text{g/mL}$)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
シスダイニン錠 500mg	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)



シスダイニン錠500mg (1錠) 投与後の血漿中濃度の推移

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²⁾

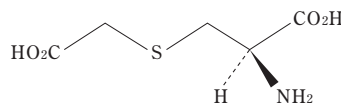
シスダイニン錠250mg及びシスダイニン錠500mgは、日本薬局方医薬品各条に定められたL-カルボシステイン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

**【薬効薬理】

L-カルボシステインは、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 (JAN)
 化学名：(2R)-2-Amino-3-carboxymethylsulfanylpropanoic acid
 分子式：C₅H₉NO₄S
 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⁴⁾

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、シスダイニン錠250mg及びシスダイニン錠500mg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。

【包装】

シスダイニン錠250mg：100錠(PTP10錠×10)
 1000錠(PTP10錠×100)
 1000錠(バラ)
 シスダイニン錠500mg：100錠(PTP10錠×10)

**【主要文献】

- 1) 武田テバ薬品(株)：社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 武田テバ薬品(株)：社内資料(溶出試験)
- 3) 第十七改正日本薬局方解説書、廣川書店 2016; C-1327
- 4) 武田テバ薬品(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。
 武田テバ薬品株式会社 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

* 発売元 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

* 製造販売元 武田テバ薬品株式会社
 大阪市中央区道修町四丁目1番1号