

** 2013年5月改訂(第8版 会社住所の変更)
* 2009年6月改訂

日本標準商品分類番号
872233

貯 法：室温保存
使用期限：外箱、容器に表示
注 意：取り扱い上の注意の項参照

気道粘液調整・粘膜正常化剤

ムコダイン[®]シロップ5%

MUCODYNE[®] Syrup 5%

(カルボシステインシロップ)

承認番号	16200AMZ00870000
薬価収載	1987年10月
販売開始	1987年10月
効能追加	1988年11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】

成分・含量 (1mL中)	日局 L-カルボシステイン 50mg
添加物	D-ソルビトール、ソルビン酸、カラメル、香料、pH調整剤
剤形	シロップ剤
色調	褐色
pH	5.5~7.5
味	甘い
におい	特異な芳香

【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
- 滲出性中耳炎の排液

【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】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)**
 - 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。]
 - 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。]
- 副作用**
総症例11,042例中、100例(0.91%)に副作用が認められ、主な副作用は食欲不振27例(0.24%)、下痢19例(0.17%)、腹痛15例(0.14%)、発疹11例(0.10%)であった。(ムコダインDSの一部変更承認時)
本項の副作用は、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。
 - 重大な副作用**
 - 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)、AI-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

	0.1~5%未満	0.1%未満	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、紅斑等	浮腫、発熱、呼吸困難
その他		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。

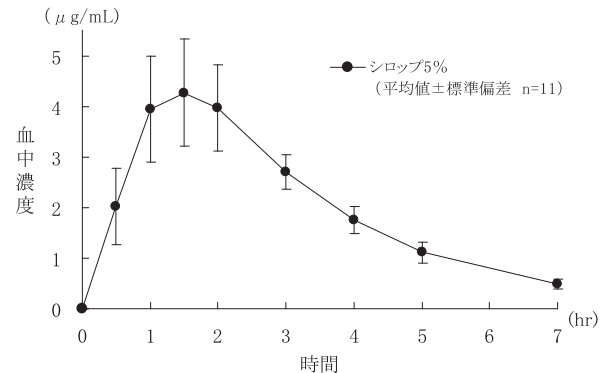
[妊娠中の投与に関する安全性が確立していない。]

【薬物動態】

血中濃度¹⁾

健康成人にカルボシステイン500mgを単回経口投与した時の血中濃度及び薬物速度論的パラメータは次のとおりである。

図 血中濃度(健康成人)



【臨床成績】

二重盲検比較試験を含む臨床試験578例について評価した成績の概要は次のとおりである。また、急性気管支炎、気管支喘息、滲出性中耳炎を対象とした二重盲検比較試験において本剤の有用性が認められている。

疾患名	有効以上	やや有効以上
上気道炎	76.2% (48/ 63)	82.5% (52/ 63)
急性気管支炎	67.0% (59/ 88)	88.6% (78/ 88)
気管支喘息	64.1% (93/145)	83.4% (121/145)
慢性副鼻腔炎	56.8% (63/111)	90.1% (100/111)
滲出性中耳炎	52.4% (89/170)	74.1% (126/170)

【薬効薬理】

1. 気道に対する作用

(1) 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、フコスの構成比を正常化する²⁾。

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する。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)生成の増加を抑制する(ラット)³⁾。

(2) 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する⁴⁾。

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する(ラット)⁵⁾。

(3) 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する(ラット)⁵⁾⁶⁾。

fMLPにより刺激したヒト好中球の活性化を抑制する⁷⁾。

(4) 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する⁸⁾。

2. 副鼻腔に対する作用

(1) 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する⁹⁾。

(2) 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、修復を促進する(ウサギ)¹⁰⁾¹¹⁾。

3. 中耳に対する作用

(1) 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する¹²⁾。

(2) 粘膜正常化作用

亜硫酸ガス(ウサギ)¹³⁾あるいは二酸化窒素(モルモット)¹⁴⁾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する。

(3) 中耳貯留液排泄促進作用

亜硫酸ガス(ウサギ)¹³⁾あるいは二酸化窒素(モルモット)¹⁴⁾曝露による実験的滲出性中耳炎病態モデルにおいて、中耳貯留液の排泄を促進する。

(4) 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する(モルモット)¹⁵⁾。

【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) [JAN]

化学名：(2R)-2-Amino-3-carboxymethylsulfanylpropanoic acid

分子式：C₅H₉N₁O₄S

分子量：179.19

融点：約186℃(分解)

性状：本品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。

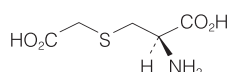
本品は水に極めて溶けにくく、エタノール(95)にほとんど溶けない。

本品は希塩酸又は水酸化ナトリウム試液に溶ける。

分配係数：1-オクタノール/水系において0.0である。

(pH2.3~8.0, 20℃)

化学構造式：



【取扱い上の注意】

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。

【包装】

ムコダインシロップ5%

瓶入包装：500mL×1本、500mL×10本

【主要文献】*」

1)上條信二, L-カルボシステインシロップ5%の生物学的同定性試験(社内資料).

2)安岡 勲, 他, 気管支学, **8**(3), 312(1986).

3)Ishibashi, Y., et al., Eur. J. Pharmacol., **487**, 7(2004).

4)Miskovits, G., et al., Forum. Ser. R. Soc. Med., **5**, 1(1982).

5)Sueyoshi, S., et al., Int. Arch. Allergy Immunol., **134**, 273(2004).

6)石橋祐二, 他, 日本呼吸器学会雑誌, **39**, 17(2001).

7)Ishii, Y., et al., Eur. J. Pharmacol., **449**, 183(2002).

8)荻原正雄, 他, 気管支学, **4**(3), 235(1982).

9)間島雄一, 他, 耳鼻臨床, **80**, 1313(1987).

10)前山拓夫, 他, 耳鼻咽喉科展望, **29**, 447(1986).

11)大橋淑宏, 他, 日本耳鼻咽喉科学会会報, **88**, 1056(1985).

12)三谷幸恵, 他, 耳鼻咽喉科展望, **39**, 69(1996).

13)大橋淑宏, 他, 日本耳鼻咽喉科学会会報, **88**, 1051(1985).

14)大橋淑宏, 他, 日本耳鼻咽喉科学会会報, **91**, 71(1988).

15)太神尚士, 他, 耳鼻咽喉科免疫アレルギー, **19**, 158(2001).

【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ください。

杏林製薬株式会社 くすり情報センター

〒101-8311 東京都千代田区神田駿河台4-6

電話 0120-409341

受付時間 9:00~17:30(土・日・祝日を除く)

** 杏林製薬株式会社

東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地