

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018（2019年更新版）に準拠して作成

## 対血管薬剤

カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム製剤

**カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg「あすか」**

**CARBAZOCHROME SULFONATE Na TABLETS**

剤形	素錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中 日局カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物30mg 含有
一般名	和名：カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物 (JAN) 洋名：carbazochrome sodium sulfonate hydrate (JAN)
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：2019年12月20日 薬価基準収載年月日：2020年6月19日 販売開始年月日：1975年8月11日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：あすか製薬株式会社 発売元：千寿製薬株式会社 販売元：武田薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	千寿製薬株式会社 カスタマーサポート室 TEL 0120-069-618 FAX 06-6201-0577 受付時間 9:00~17:30（土、日、祝日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.senju.co.jp/">https://www.senju.co.jp/</a>

※本IFは2024年1月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

※最新の情報は、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。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

(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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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I F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I F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、I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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I F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I F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。

I F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. I Fの利用にあたって

電子媒体のI F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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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、I F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、I F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、I F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

I F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。I F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I F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、I F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

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	1
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 .....	2
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	3
1. 販 売 名 .....	3
2. 一 般 名 .....	3
3. 構造式又は示性式 .....	3
4. 分子式及び分子量 .....	3
5. 化学名（命名法）又は本質 .....	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	4
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	5
1. 物理化学的性質 .....	5
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	5
3. 有効成分の確認試験法、定量法 .....	5
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	6
1. 剤 形 .....	6
2. 製剤の組成 .....	6
3. 添付溶解液の組成及び容量 .....	7
4. 力 価 .....	7
5. 混入する可能性のある夾雑物 .....	7
6. 製剤の各種条件下における安定性 .....	7

7. 調製法及び溶解後の安定性	7
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	7
9. 溶出性	7
10. 容器・包装	10
11. 別途提供される資材類	10
12. その他	10
<b>V. 治療に関する項目</b>	<b>11</b>
1. 効能又は効果	11
2. 効能又は効果に関連する注意	11
3. 用法及び用量	11
4. 用法及び用量に関連する注意	11
5. 臨床成績	11
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b>	<b>13</b>
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	13
2. 薬理作用	13
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b>	<b>15</b>
1. 血中濃度の推移	15
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	16
5. 分布	16
6. 代謝	16
7. 排泄	17
8. トランスポーターに関する情報	17
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

<b>Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	18
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.....	19
10. 過量投与.....	20
11. 適用上の注意.....	20
12. その他の注意.....	20
<b>Ⅸ. 非臨床試験に関する項目</b> .....	21
1. 薬理試験.....	21
2. 毒性試験.....	23
<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	24
1. 規制区分.....	24
2. 有効期間.....	24
3. 包装状態での貯法.....	24
4. 取扱い上の注意.....	24
5. 患者向け資材.....	24
6. 同一成分・同効薬.....	24
7. 国際誕生年月日.....	24
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.....	25
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.....	25
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	25
11. 再審査期間.....	25

12. 投薬期間制限に関する情報	25
13. 各種コード	25
14. 保険給付上の注意	25
<b>XI. 文 献</b>	26
1. 引用文献	26
2. その他の参考文献	26
<b>XII. 参考資料</b>	26
1. 主な外国での発売状況	26
2. 海外における臨床支援情報	26
<b>XIII. 備 考</b>	27
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	27
2. その他の関連資料	27

## 略語表

略語	略語の内容
CCS	カルバゾクロムスルホン酸
CYP	チトクローム P 450
LD <sub>50</sub>	50%致死量

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

アドレナリンの生体内酸化物として、止血作用を有するアドレノクロムが1937年に発見された。しかし、このアドレノクロムは不安定な物質であり、医薬品としての製剤化に困難を来した。その後の研究によりアドレノクロムの5位のケトン基をセミカルバゾンにすることで安定性が図れるようになり、カルバゾクロムが開発された。

カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物は、さらに水溶性を高めた物質として開発されたものである。

タジン錠30は、グレラン製薬（現あすか製薬）が後発医薬品として開発し、1974年8月に承認を取得、1975年8月から販売している。

その後、医療事故防止対策の一環とした販売名変更により2019年12月に『カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg「あすか」』として承認を取得した。

## 2. 製品の治療学的特性

- 毛細血管抵抗性の減弱及び透過性の亢進によると考えられる出血傾向（例えば紫斑病など）の効能及び効果を有する。〔11 ページ参照〕
- 毛細血管抵抗性の減弱による皮膚あるいは粘膜及び内膜からの出血、眼底出血・腎出血・子宮出血の効能及び効果を有する。〔11 ページ参照〕
- 毛細血管抵抗性の減弱による手術中・術後の異常出血の効能及び効果を有する。〔11 ページ参照〕

## 3. 製品の製剤学的特性

該当しない

## 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

カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg 「あすか」

#### (2) 洋名

CARBAZOCHROME SULFONATE Na TABLETS

#### (3) 名称の由来

一般名+剤形+含量+屋号

### 2. 一般名

#### (1) 和名(命名法)

カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物 (JAN)

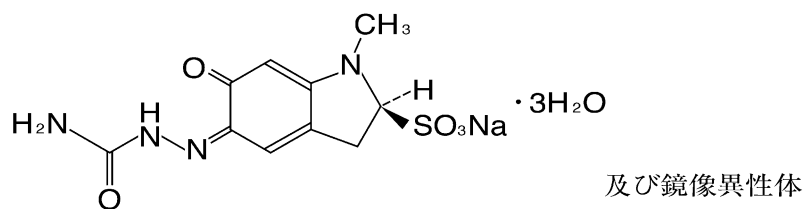
#### (2) 洋名(命名法)

Carbazochrome Sodium Sulfonate Hydrate (JAN)

#### (3) ステム

不明

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式 :  $C_{10}H_{11}N_4NaO_5S \cdot 3H_2O$

分子量 : 376.32

### 5. 化学名(命名法)又は本質

Monosodium(2*RS*)-1-methyl-6-oxo-5-semicarbazono-2,3,5,6-tetrahydroindole-2-sulfonate trihydrate (IUPAC)

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

橙黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

水にやや溶けにくく、メタノール又はエタノール（95）に極めて溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

##### (3) 吸湿性

3水塩では相対湿度7.0～93.0%（25℃）で安定である。

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約210℃（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

水溶液（1→100）は旋光性を示さない。

本品0.8gを水50mLに加温して溶かし、冷却した液のpHは5.0～6.0である。

#### 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

日本薬局方「カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

(3) ナトリウム塩の定性反応

##### 定量法

日本薬局方「カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物」の定量法による。

電位差滴定法




## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形


#### (1) 剤形の区別

素錠

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg 「あすか」		
剤形	だいたい色 素錠		
外形	表	側面	裏
			
直径8.0mm 厚さ3.1mm 質量200mg			

#### (3) 識別コード

販売名	カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg 「あすか」
識別コード	 306

識別コードは錠剤表面、PTPシート表面に表示

#### (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

販売名	カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg 「あすか」
有効成分	1錠中 カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物 30mg
添加剤	結晶セルロース、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、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

#### (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. カ 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

長期保存試験

保存条件	保存期間	保存形態	結 果
室温	4年	PTP+セロポリピロー包装	規格内

[測定項目] 性状、確認試験、質量偏差試験、溶出性、定量

### 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）

該当資料なし

### 9. 溶 出 性

#### (1) 溶出規格への適合性

公的溶出規格への適合

カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg「あすか」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

試験条件	溶出規格		実測値
	規定時間	溶出率	
水、パドル法、50rpm	15分	80%以上	86.9～94.1%

## (2) 溶出挙動の類似性

カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg「あすか」について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従いアドナ錠30mgを標準製剤として溶出挙動を比較した結果、溶出性において類似性が確認された。

### [試験方法]

日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 (パドル法、50rpm)

試験液量：900mL

試験液：pH1.2－日局溶出試験第1液

pH4.0－薄めたMcIlvaine緩衝液

pH6.8－日局溶出試験第2液

水

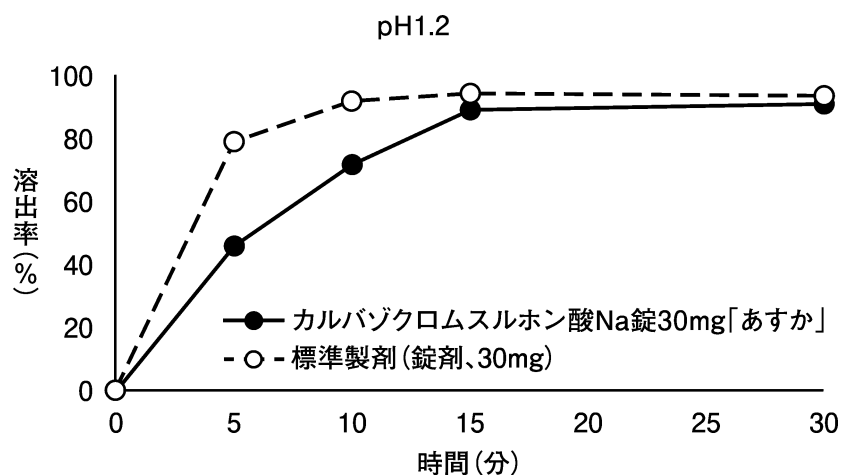
### [判定基準]

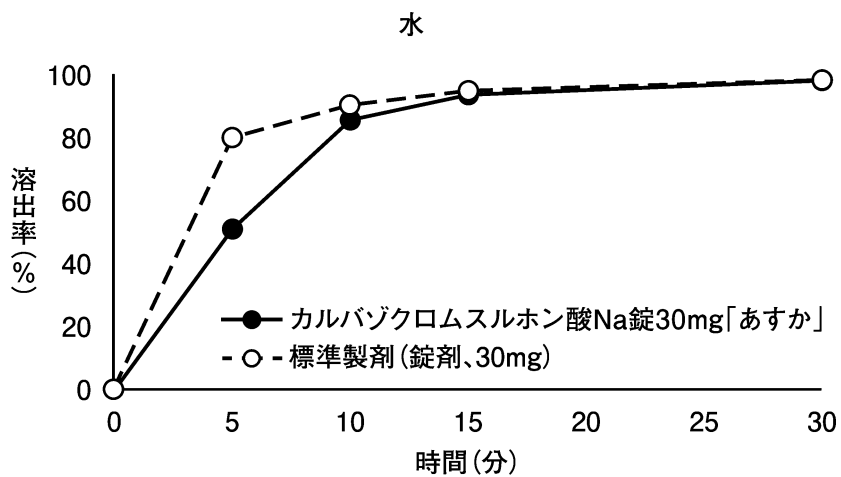
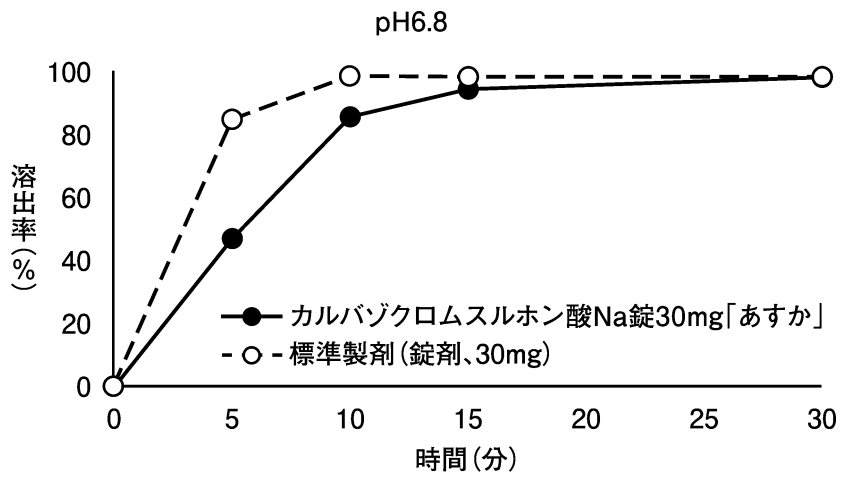
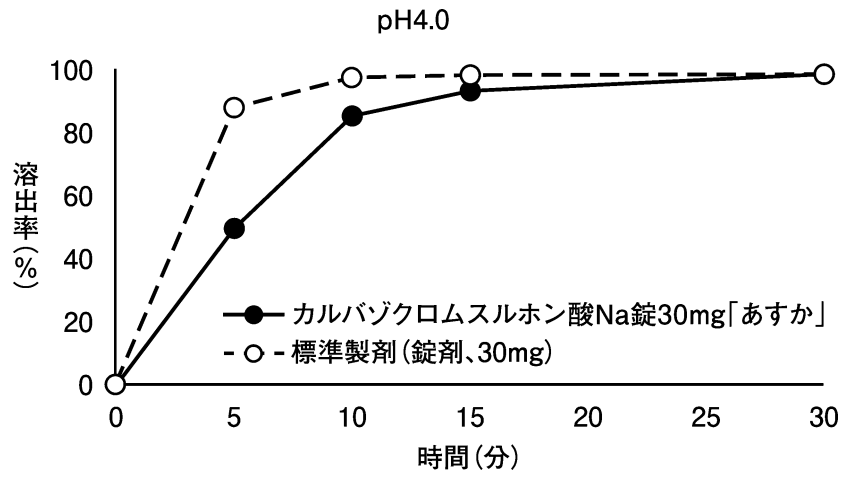
15分以内に平均85%以上溶出する。

### [試験結果]

回転数 (rpm)	試験液	判定時間 (分)	標準製剤 平均溶出率 (%)	試験製剤 平均溶出率 (%)	判定基準 (平均溶出率)	判定
50	pH1.2	15	94.5	89.2	85%以上	適合
	pH4.0	15	99.1	93.8	85%以上	適合
	pH6.8	15	98.5	94.2	85%以上	適合
	水	15	96.0	93.7	85%以上	適合

### [溶出曲線]







## 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

600錠 [10錠(PTP)×60]、1,200錠 [10錠(PTP)×120]

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

PTPシート：ポリ塩化ビニル、アルミニウム

ピロー：セロファン、ポリエチレン

## 11. 別途提供される資材類

該当しない

## 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

- 毛細血管抵抗性の減弱及び透過性の亢進によると考えられる出血傾向(例えば紫斑病など)
- 毛細血管抵抗性の減弱による皮膚あるいは粘膜及び内膜からの出血、眼底出血・腎出血・子宮出血
- 毛細血管抵抗性の減弱による手術中・術後の異常出血

### 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

カルバズクロムスルホン酸ナトリウム水和物として、通常成人1日30～90mgを3回に分割経口投与する。

なお、年齢、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

該当しない

#### (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

###### 国内臨床試験

- ・血管脆弱の認められる高血圧症及び動脈硬化症41例を対象とした二重盲検比較試験の結果、血管抵抗値の有意な増強効果が認められている<sup>1)</sup>。
- ・血管脆弱の認められる高血圧症・糖尿病・紫斑病等の患者51例を対象とした二重盲検比較試験の結果、血管抵抗値を有意に増強し、皮下出血等の出血症状を改善することが確認されている<sup>2)</sup>。

##### 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

該当しない

#### (7) その他

###### 臨床効果

- ・カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg「あすか」（カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物として1日量90mg）を毛細血管抵抗減弱の35例に10週間投与し、著効4例（11.4%）、有効10例（28.6%）、やや有効11例（31.4%）、無効10例（28.6%）の成績を得、副作用はみられなかった<sup>3)</sup>。
- ・カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg「あすか」1日3錠を血管性紫斑病、血小板減少性紫斑病、鉄欠乏性貧血、腎炎及びSLE等の血管脆弱が認められ、評価し得た患者10例に対し、有効7例（70.0%）、やや有効3例（30.0%）を得た。副作用は全投与例25例（1日3～6錠投与例）中5例に胃腸症状が発現したが、一過性であった<sup>4)</sup>。

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

カルバゾクロム

アドレノクロムモノアミングアニジンメシル酸塩水和物

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

細血管に作用して、血管透過性亢進を抑制し、血管抵抗値を増強する。血液凝固・線溶系に影響を与えることなく出血時間を短縮し、止血作用を示す。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 血管透過性抑制作用

- ・ウサギ 5、10mg/kg 筋肉内投与により、カリクレインによる血管透過性亢進を投与後 60 分で各々20%、30%抑制する<sup>5)</sup>。
- ・ウサギ 0.5、2.5、5.0mg/kg 静脈内投与により、ヒアルロニダーゼ拡散率を抑制し、特に2.5～5 mg/kg投与群で著しい<sup>6)</sup>。
- ・馬杉腎炎ラットの尿中蛋白及び尿中アルカリフォスファターゼの増加を抑制する (Exton 変法、Kind-king 法：皮下)。腎炎の尿中蛋白は主に糸球体毛細血管の透過性亢進によるものとされている<sup>7)</sup>。

##### 2) 細血管抵抗値増強作用

- ・馬杉腎炎ラットの低下した血管抵抗値を、投与用量に応じ、対照群に比べ有意に増大させる (皮下)。また、正常ラットにおいても血管抵抗値を増大させる (von Borbély 式改良法：経口)<sup>7)</sup>。
- ・ウサギ 10mg/kg 筋肉内投与により、瞬膜血管抵抗値を投与後 60 分で1.3 倍増強する<sup>5)</sup>。

##### 3) 出血時間短縮作用

- ・ウサギ 2.5、5.0mg/kg 静脈内投与により、出血時間を投与後 60 分で各々18%、42%短縮し、その作用は3 時間以上持続する<sup>6)</sup>。

##### 4) 血小板、血液凝固系に対する作用

- ・ウサギ 5.0mg/kg 静脈内投与において、血小板数の変化は認められない<sup>6)</sup>。
- ・ウサギ 4.0mg/kg 筋肉内投与において、血液凝固時間の変化は認められない<sup>8)</sup>。

5) 呼吸系、循環系に対する作用

- ・ウサギ 5.0、10.0mg/kg 静脈内投与において、呼吸、血圧の変化は認められない<sup>8、9)</sup>。
- ・ウサギ 4%液耳血管灌流及び $5 \times 10^{-4}$ 液摘出腸間膜血管灌流において、血管の収縮は認められない<sup>8、9)</sup>。

(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

健康成人男子に150mg（5錠）経口投与した場合速やかに血中に移行し、血中濃度は0.5～1時間後に最高（25ng/mLplasma）に達する。

血中濃度の半減期は約1.5時間である。

注）本剤の承認された用法及び用量は、1日30～90mgを3回に分割経口投与である。

#### (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

該当資料なし

#### (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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(6) 授乳婦」の項 (P.19) 参照

#### (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

(1) 排泄経路

尿中排泄

(2) 排 泄 率

尿中排泄動態は血中濃度の推移とよく対応し、投与後0.5～1.5時間で最大となり、24時間までに排泄される。

ウサギに静脈内投与したときの血中濃度は、1分後に最高となり、生物学的半減期は、約5分である。また、尿中には2分後より出現し、180分までに投与量の40～50%が尿中に排泄される。

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

該当資料なし

11. そ の 他

雄性シロウサギにカルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg「あすか」とアドナ錠30mgそれぞれカルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物として60mgをクロスオーバー法により単回経口投与してカルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物の尿中排泄量を測定した結果、両剤間の尿中排泄量に有意差は認められなかった<sup>10)</sup>。



## 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

設定されていない

### 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. 特定の背景を有する患者に関する注意 9.1 合併症・既往歴等のある患者 9.1.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
---

#### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

#### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

#### (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、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。
--

(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

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(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

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 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、胃部不快感	悪心、嘔吐	
過敏症			発疹、そう痒

注) 再評価結果を含む

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の代謝物により、尿ウロビリノーゲン試験が陽性になることがある。  
また、だいたい黄色がかった着色尿があらわれることがある。

## 10. 過量投与

設定されていない

## 11. 適用上の注意

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

(解説) PTPシートの誤飲防止のため、PTP製剤に共通の注意事項(平成22年9月15日付 医政総発0915第2号、薬食総発0915第5号、薬食安発0915第1号)として記載した。

## 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 (P. 13) 参照

#### (2) 安全性薬理試験

##### 1) 一般症状に及ぼす影響

CCS 100mg/kgでは特記すべき症状はみられなかった。

316mg/kgでは30分頃から軽度の呼吸亢進、自発運動亢進、振せん、発声のみられたが3時間後には大部分の症状が回復した。

1,000mg/kgではさらにgrooming (身づくろい動作)、触反応亢進、尿量増加のみられた。

3,160mg/kgでは上記症状以外に眼球突出、異常歩行、立毛のみられ、これらの症状の多くは3時間以上持続した。

##### 2) 麻酔遷延作用

CCS 62.5~250mg/kg投与において正向反射の消失は認められず、またpentobarbitalによる正向反射の消失時間も対照群との有意な差が認められなかった。

これに対しchlorpromazine 10mg/kgでは6/6例に正向反射の消失のみられた。

##### 3) 抗痙攣作用

CCS 62.5~250mg/kg投与において抗痙攣作用はみられなかった。

これに対しdiazepam 3mg/kgでは4/6例に抗痙攣作用が認められた。

##### 4) 鎮痛作用

CCS 62.5~250mg/kg投与においてwrithing (身もだえする) の回数は、対照群との間に有意な差は認められなかった。

これに対しaspirin 100mg/kg投与では71%の抑制作用を示した。

マウス酢酸writhing回数に対するCCSの鎮痛効果

薬 剤	用量 (mg/kg)	Writhingの回数 (x±S.E.)
Control	—	36.8±3.9
CCS	250	34.3±4.9
	125	36.7±5.3
	62.5	35.8±2.9
Aspirin	50	10.5±2.1

5) 抗炎症作用

CCS 62.5~250mg/kg投与において浮腫の抑制作用は認められなかった。

これに対しphenylbutazone 50mg/kg投与では有意 ( $p < 0.05$ ) な抑制作用が認められた。

ラットカラゲニン浮腫に対するCCSの効果

薬 剤	用量 (mg/kg)	脚体積の増加差 ( $\mu\text{L}$ )
Control	—	568 $\pm$ 23
CCS	250	583 $\pm$ 43
	125	555 $\pm$ 32
	62.5	561 $\pm$ 39
Phenylbutazone	50	248 $\pm$ 39

6) 利尿作用

CCS 62.5~250mg/kg投与において尿量は対照群との有意な差は認められなかった。

これに対しchlorothiazide 50mg/kg投与では尿量を100%増加させた。

ラット尿量に対するCCSの効果

薬 剤	用量 (mg/kg)	尿量 (mL)
Control	—	15.9
CCS	250	18.0
	125	11.2
	62.5	14.6
Chlorothiazide	50	32.1

7) 血管刺激性

日本シロウサギ (体重2.5~3.0kg) にてCCS 0.5%溶液0.05mLを耳静脈より投与し3分間貯留する操作を1日3回、20日間行い、血栓の発生頻度を調べたが、1例も認められなかった。

(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

LD<sub>50</sub> (mg/kg、168時間値)

動物 \ 投与経路	経口	静脈内
ラット (♂)	>6,000	>1,580
ラット (♀)	>6,000	>1,580

### (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：カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg「あすか」 該当しない

有効成分：該当しない

### 2. 有効期間

有効期間：4年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

設定されていない

### 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

その他の患者向け資材：なし

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分：アドナ錠10mg・30mg、アドナ散10%

同 効 薬：アドレノクロムモノアミノグアニジンメシル酸塩水和物、カルバゾクロム・アスコ  
ルビン酸配合錠、アスコルビン酸（ビタミンC）、フィトナジオン（ビタミンK<sub>1</sub>）、  
フィブリノーゲン、プロタミン硫酸塩、トラネキサム酸

### 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

カルバゾクロムスルホン酸Na錠30mg「あすか」

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
旧販売名 タジン錠30	1974年 8 月 30日	14900AMZ00331000	1975年 1 月 1 日	1975年 8 月 11日
販売名変更 カルバゾクロムスルホン酸 Na錠30mg「あすか」	2019年12月20日	30100AMX00316000	2020年 6 月 19日	1975年 8 月 11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

再評価

公表年月日：1979年 2 月 2 日

再評価結果：有効性が認められるもの（効能又は効果の変更なし）

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は投与期間に関する制限は定められていない。

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 (13桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
カルバゾクロム スルホン酸Na錠 30mg「あすか」	3321002F2013	3321002F2455	1079876010301 (10錠×60) 1079876010302 (10錠×120)	620798701

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。



## XI. 文 献

### 1. 引用文献

- 1) 堀 慶久 他：臨牀と研究. 1974 ; 51(7) : 1953-1965
- 2) 加藤作郎 他：臨牀と研究. 1975 ; 52(5) : 1567-1585
- 3) 遠藤 馨：現代の診療. 1981 ; 23(3) : 403-414
- 4) 陰山 克 他：臨床と研究. 1977 ; 54(4) : 1268-1276
- 5) 小寺 稔 他：臨牀と研究. 1966 ; 43(2) : 357-362
- 6) 志水 浩 他：診療と新薬. 1965 ; 2 : 421-426
- 7) 府川和永 他：応用薬理. 1978 ; 15(7) : 1121-1131
- 8) 蛭間政和 他：大阪市立大学医学雑誌. 1957 ; 6 : 793-799
- 9) 小澤 光 他：薬学雑誌. 1956 ; 76(12) : 1408-1414
- 10) 社内資料：生物学的同等性試験

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当しない

## 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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(掲載根拠：「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するQ&Aについて（その3）」令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課事務連絡)

#### (1) 粉 砕

参考情報については、表紙に記載の「問い合わせ窓口」に個別に照会すること。

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

参考情報については、表紙に記載の「問い合わせ窓口」に個別に照会すること。

### 2. その他の関連資料

該当資料なし

