

貯 法：室温保存（吸湿性が強い
ので、SP包装開封後は
速やかに使用すること）

使用期限：外箱に表示の使用期限内
に使用すること

注 意：「取扱上の注意」の項参照
処方箋医薬品
（注意－医師等の処方箋
により使用すること）

レボカルニチン製剤

レボカルニチン塩化物錠100mg「フソー」

レボカルニチン塩化物錠300mg「フソー」

Levocarnitine Chloride Tablets


〈レボカルニチン塩化物錠〉

	100mg	300mg
承認番号	22700AMX00931	22700AMX00932
薬価収載	2015年12月	2015年12月
販売開始	2015年12月	2015年12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	レボカルニチン塩化物錠100mg「フソー」	レボカルニチン塩化物錠300mg「フソー」	
成分・分量 (1錠中)	レボカルニチン塩化物 100mg	レボカルニチン塩化物 300mg	
添加物	ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン		
色・剤形	白色のフィルムコーティング錠		
外形	表面		
	裏面		
	側面		
大きさ	直径	7.1mm	10.2mm
	厚さ	3.3mm	4.9mm
質量	約133mg	約395mg	
識別コード	FS/L1	FS/L2	

【効能・効果】

カルニチン欠乏症

〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

- (1)本剤は、臨床症状・検査所見からカルニチン欠乏症と診断された場合あるいはカルニチン欠乏症が発症する可能性が極めて高い状態である場合にのみ投与すること。
- (2)本剤の投与に際しては、原則として、カルニチンの欠乏状態の検査に加え、カルニチン欠乏の原因となる原疾患を特定すること。

【用法・用量】

通常、成人には、レボカルニチン塩化物として、1日1.8～3.6gを3回に分割経口投与する。なお、患者の状態に応じて適宜増減する。

通常、小児には、レボカルニチン塩化物として、1日体重1kgあたり30～120mgを3回に分割経口投与する。なお、患者の状態に応じて適宜増減する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

- (1)本剤の投与に際しては、低用量から投与を開始し、臨床症状の改善の程度と副作用の発現の程度及び定期的な臨床検査、バイタルサイン、カルニチンの欠乏状態等から投与量を総合的に判断すること。また、増量する場合には慎重に判断し、漫然と投与を継続しないこと。
- (2)血液透析患者への本剤の投与に際しては、高用量を長期間投与することは避け、本剤投与により期待する効果が得られない場合には、漫然と投与を継続しないこと。また、血液透析日には透析終了後に投与すること。（「慎重投与」の項参照）
- (3)小児への投与に際しては、原則として、成人用量を超えないことが望ましい。

〈参考〉

本剤は、レボカルニチン塩化物1,800mgでレボカルニチン1,500mgに相当する。

【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）

重篤な腎機能障害のある患者又は透析下の末期腎疾患患者
〔本剤の高用量の長期投与により、トリメチルアミン等の有害な代謝物が蓄積するおそれがある。低用量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与し、漫然と投与を継続しないこと。重篤な腎機能障害のある患者に対する有効性及び安全性は確立されていない。〕

2. 重要な基本的注意

本剤投与中は、定期的にバイタルサイン、臨床検査（血液検査、肝・腎機能検査、尿検査）、カルニチンの欠乏状態のモニタリングを行うことが望ましい。

3. 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。

	頻度不明
消化器	食欲不振、下痢、軟便、腹部膨満感
過敏症	発疹、痒痒感
その他	顔面浮腫、血尿、貧血

4. 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ため、患者の状態を観察し、減量するなど十分に注意しながら本剤を投与すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人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。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (2)授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、投与する場合は授乳を避けさせること。〔動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。〕

6. 小児等への投与

低出生体重児，新生児，乳児に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。

7. 適用上の注意

錠剤を嚥下することが困難な場合には水に懸濁して投与してもさしつかえない。

【薬物動態】

◇生物学的同等性試験

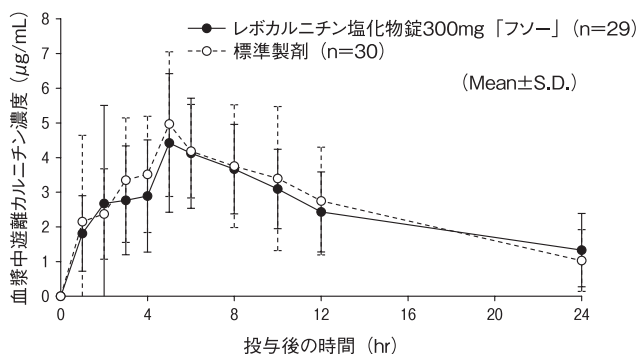
(1)レボカルニチン塩化物錠300mg「フソー」

レボカルニチン塩化物錠300mg「フソー」と標準製剤を，クロスオーバー法によりそれぞれ4錠（レボカルニチン塩化物として1200mg）健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中遊離カルニチン濃度を測定し，得られた薬物動態パラメータ（AUC， C_{max} ）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果， $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり，両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

なお，血漿中遊離カルニチン濃度及び薬物動態パラメータ算出には，投与前の血漿中濃度（内因性遊離カルニチン濃度）を差し引いた値を用いた。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0-24hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	C_{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	t_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
レボカルニチン塩化物錠300mg「フソー」	59.227 (22.914)	5.559 (2.189)	5.7 (2.5)	14.271 (14.372)
標準製剤 (錠剤，300mg)	60.150 (24.884)	5.789 (2.381)	5.8 (2.5)	7.723 (4.163)

Mean (S.D.), n=29



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，血液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2)レボカルニチン塩化物錠100mg「フソー」

レボカルニチン塩化物錠100mg「フソー」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成24年2月29日，薬食審査発0229第10号）」に基づき，レボカルニチン塩化物錠300mg「フソー」を標準製剤としたとき，溶出挙動が等しく，生物学的に同等とみなされた²⁾。

◇溶出挙動

レボカルニチン塩化物錠100mg「フソー」及びレボカルニチン塩化物錠300mg「フソー」は，日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた塩化レボカルニチン錠の溶出規格に適合していることが確認されている³⁾。

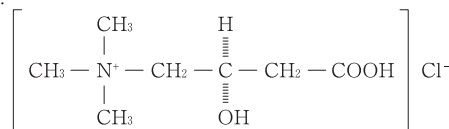
【薬効薬理】

カルニチンは，トリアシルグリセリドの異化などにより供給される心筋および骨格筋においてエネルギー産生に重要な長鎖脂肪酸のミトコンドリア内への運搬に関わっている。ミトコンドリア内においては，アセチル基をアセチルカルニチンとして細胞質へ輸送する。また，過剰となったアシル基を腎臓から再吸収を受けずに排泄されるアシルカルニチンとして排泄する⁴⁾。

※【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：レボカルニチン塩化物（Levocarnitine Chloride）

構造式：



分子式：C₇H₁₆ClNO₃

分子量：197.66

化学名：(-)-(R)-(3-Carboxy-2-hydroxypropyl)

trimethylammonium chloride

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。水に極めて溶けやすく，メタノール，エタノール（95）又は酢酸（100）に溶けやすい。潮解性である。水溶液（1→50）はpH2.0～2.5である。

旋光度：[α]_D²⁰：-23.0～-24.0°

（脱水物に換算したのも1g，水，50mL，100mm）

融点：137～141℃

【取扱い上の注意】

本剤の主成分は潮解性を有するので，服用直前にSP包装（アルミシート）から錠剤を取り出すこと。

◇安定性試験

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，各試験項目は規格の範囲内であり，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⁵⁾。

【包装】

レボカルニチン塩化物錠100mg「フソー」（SP） 100錠（10錠×10）

500錠（10錠×50）

レボカルニチン塩化物錠300mg「フソー」（SP） 100錠（10錠×10）

500錠（10錠×50）

【主要文献及び文献請求先】

- 1) 扶桑薬品工業株式会社（生物学的同等性試験）社内資料
- 2) 扶桑薬品工業株式会社（生物学的同等性試験）社内資料
- 3) 扶桑薬品工業株式会社（溶出試験）社内資料
- 4) 松井朝義 ほか，生体試料分析，35，271（2012）
- 5) 扶桑薬品工業株式会社（安定性試験）社内資料

【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。

扶桑薬品工業株式会社 研究開発センター 学術部門
〒536-8523 大阪市城東区森之宮二丁目3番30号
TEL 06-6964-2763 FAX 06-6964-2706
(9:00～17:30/土日祝日を除く)

製造販売元



扶桑薬品工業株式会社

大阪市城東区森之宮二丁目3番11号

DK-906-906A