※※2021年９月改訂（第８版）
※2016年10月改訂

日本標準商品分類番号
８７２１４９

慢性心不全治療剤

処方箋医薬品注）

日本薬局方　カルベジロール錠
カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」

持続性 高血圧・狭心症治療剤
慢性心不全治療剤
頻脈性心房細動治療剤

処方箋医薬品注）

日本薬局方　カルベジロール錠
カルベジロール錠10mg「ファイザー」

慢性心不全治療剤
頻脈性心房細動治療剤

処方箋医薬品注）

日本薬局方　カルベジロール錠
カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」

持続性 高血圧・狭心症治療剤
頻脈性心房細動治療剤

処方箋医薬品注）

日本薬局方　カルベジロール錠
カルベジロール錠20mg「ファイザー」

CARVEDILOL Tablets 1.25mg･2.5mg･10mg･20mg [Pfizer]

貯　　法：室温保存、気密容器
使用期限：最終年月を外箱等に記載
（取扱い上の注意参照）

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

	1.25mg	2.5mg	10mg	20mg
承認番号	22800AMX00162	22800AMX00163	22400AMX01281	22400AMX01282
薬価収載	2016年６月		2012年12月	
販売開始	2016年６月		2012年12月	
効能追加	―	2016年５月	2016年１月	

【警　告】

慢性心不全患者に使用する場合には、慢性心不全治療の経験が十分にある医師のもとで使用すること。

【禁　忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 気管支喘息、気管支痙攣のおそれのある患者［気管支筋を収縮させることがあるので喘息症状の誘発、悪化を起こすおそれがある。］
2. 糖尿病性ケトアシドーシス、代謝性アシドーシスのある患者［心筋収縮力の抑制が増強されるおそれがある。］
3. 高度の徐脈（著しい洞性徐脈）、房室ブロック（Ⅱ、Ⅲ度）、洞房ブロックのある患者［症状が悪化するおそれがある。］
4. 心原性ショックの患者［循環不全症が悪化するおそれがある。］
5. 強心薬又は血管拡張薬を静脈内投与する必要のある心不全患者［心収縮力抑制作用により、心不全が悪化するおそれがある。］
6. 非代償性の心不全患者［心収縮力抑制作用により、心不全が悪化するおそれがある。］
7. 肺高血圧による右心不全のある患者［心拍出量が抑制され症状が悪化するおそれがある。］
8. 未治療の褐色細胞腫の患者［「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照］
9. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人［「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照］
10. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

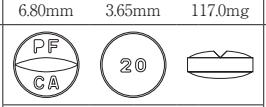
【組成・性状】

1.組成

1錠中：

販売名／成分	カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」	カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」	カルベジロール錠10mg「ファイザー」	カルベジロール錠20mg「ファイザー」
有効成分	日局カルベジロール1.25mg	日局カルベジロール2.5mg	日局カルベジロール10.0mg	日局カルベジロール20.0mg
添加物	D-マンニトール、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、含水二酸化ケイ素、炭酸水素ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、プロピレングリコール、酸化チタン、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ	D-マンニトール、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、含水二酸化ケイ素、炭酸水素ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、プロピレングリコール、酸化チタン、カルナウバロウ	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、含水二酸化ケイ素、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6000、酸化チタン、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ	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、含水二酸化ケイ素、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6000、酸化チタン、カルナウバロウ

2.性状

販売名	外形 上面	外形 下面	外形 側面	識別コード	色調等
カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」		長径 10.1mm　短径 5.1mm　厚さ 3.2mm　重量 135mg		PF CA 1.25	黄色 楕円形 割線入り フィルムコーティング錠
カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」		長径 10.1mm　短径 5.1mm　厚さ 3.2mm　重量 135mg		PF CA 2.5	白色 楕円形 割線入り フィルムコーティング錠
カルベジロール錠10mg「ファイザー」		直径 6.80mm　厚さ 3.65mm　重量 117.0mg		PF CA 10	黄色 フィルムコーティング錠
カルベジロール錠20mg「ファイザー」		直径 8.65mm　厚さ 3.30mm　重量 182.0mg		PF CA 20	白色～微黄白色 割線入り フィルムコーティング錠

【効能・効果】

本態性高血圧症（軽症～中等症）
腎実質性高血圧症
狭心症
次の状態で、アンジオテンシン変換酵素阻害薬、利尿薬、ジギタリス製剤等の基礎治療を受けている患者
　虚血性心疾患又は拡張型心筋症に基づく慢性心不全
頻脈性心房細動
＜参考＞

効能・効果	錠1.25mg	錠2.5mg	錠10mg	錠20mg
本態性高血圧症（軽症～中等症）	－	－	○	○
腎実質性高血圧症	－	－	○	○
狭心症	－	－	○	○
虚血性心疾患又は拡張型心筋症に基づく慢性心不全	○	○	○	－
頻脈性心房細動	－	○	○	○

○：効能あり　－：効能なし

【用法・用量】

本態性高血圧症（軽症～中等症）、腎実質性高血圧症
　カルベジロールとして、通常、成人１回10～20mgを１日１回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。
狭心症
　カルベジロールとして、通常、成人１回20mgを１日１回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。
虚血性心疾患又は拡張型心筋症に基づく慢性心不全
　カルベジロールとして、通常、成人１回1.25mg、１日２回食後経口投与から開始する。１回1.25mg、１日２回の用量に忍容性がある場合には、１週間以上の間隔で忍容性をみながら段階的に増量し、忍容性がない場合は減量する。用量の増減は必ず段階的に行い、１回投与量は1.25mg、2.5mg、５mg又は10mgのいずれかとし、いずれの用量においても、１日２回食後経口投与とする。通常、維持量として１回2.5～10mgを１日２回食後経口投与する。
　なお、年齢、症状により、開始用量はさらに低用量としてもよい。また、患者の本剤に対する反応性により、維持量は適宜増減する。
頻脈性心房細動
　カルベジロールとして、通常、成人１回５mgを１日１回経口投与から開始し、効果が不十分な場合には10mgを１日１回、20mgを１日１回へ段階的に増量する。なお、年齢、症状により適宜増減するが、最大投与量は20mgを１日１回までとする。

[用法・用量に関連する使用上の注意]

1.褐色細胞腫の患者では、単独投与により急激に血圧が上昇するおそれがあるので、α遮断薬で初期治療を行った後に本剤を投与し、常にα遮断薬を併用すること。
2.慢性心不全を合併する本態性高血圧症、腎実質性高血圧症、狭心症又は頻脈性心房細動の患者では、慢性心不全の用法・用量に従うこと。
3.**慢性心不全の場合**
　(1)慢性心不全患者に投与する場合には、**必ず１回1.25mg又はさらに低用量の、１日２回投与から開始**し、忍容性及び治療上の有効性を基に**個々の患者に応じて維持量を設定する**こと。
　(2)本剤の**投与初期及び増量時**は、心不全の悪化、浮腫、体重増加、めまい、低血圧、徐脈、血糖値の変動、及び腎機能の悪化が起こりやすいので、**観察を十分に行い、忍容性を確認する**こと。
　(3)本剤の投与初期又は増量時における心不全や体液貯留の悪化（浮腫、体重増加等）を防ぐため、本剤の**投与前に体液貯留の治療を十分に行う**こと。心不全や体液貯留の悪化（浮腫、体重増加等）がみられ、利尿薬増量で改善がみられない場合には本剤を減量又は中止すること。低血圧、めまいなどの症状がみられ、アンジオテンシン変換酵素阻害薬や利尿薬の減量により改善しない場合には本剤を減量すること。高度な徐脈を来たした場合には、本剤を減量すること。また、これら症状が安定化するまで本剤を増量しないこと。
　(4)**本剤を中止する場合**には、急に投与を中止せず、原則として**段階的に**半量ずつ、2.5mg又は1.25mg、１日２回まで１～２週間かけて**減量し中止する**こと。
　(5)**２週間以上休薬した後、投与を再開する場合**には、「用法･用量」の項に従って、**低用量から開始し、段階的に増量する**こと。
4.頻脈性心房細動を合併する本態性高血圧症、腎実質性高血圧症又は狭心症の患者に投与する場合には、頻脈性心房細動の用法・用量は１日１回５mg投与から開始することに留意した上で、各疾患の指標となる血圧や心拍数、症状等に応じ、開始用量を設定すること。

【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)特発性低血糖症、コントロール不十分な糖尿病、絶食状態、栄養状態が不良の患者［低血糖症状を起こしやすく、かつその症状をマスクしやすいので血糖値に注意すること。］
　(2)糖尿病を合併した慢性心不全患者［血糖値が変動するおそれがある。］
　(3)重篤な肝機能障害のある患者［血中濃度が上昇するので、投与量を減ずるか投与間隔をあけて使用すること。また、肝機能が悪化するおそれがある。］
　(4)重篤な腎機能障害のある患者［血中濃度の上昇が報告されている。また、特に慢性心不全の患者では腎機能が悪化するおそれがある。］
　(5)房室ブロック（Ⅰ度）のある患者［房室伝導時間が延長し、症状が悪化するおそれがある。］
　(6)徐脈のある患者［症状が悪化するおそれがある。］
　(7)末梢循環障害のある患者（レイノー症候群､間欠性跛行症等）［末梢血管の拡張を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。］
　(8)過度に血圧の低い患者［血圧をさらに低下させるおそれがある。］
　(9)高齢者［「高齢者への投与」の項参照］

2.重要な基本的注意
　※(1)投与が**長期にわたる場合**は、**心機能検査**（脈拍、血圧、心電図、X線等）**を定期的に行う**こと。また、徐脈となったとき及び低血圧を起こした場合には、ショックに至る例も報告されているので、観察を十分に行い本剤を減量又は中止すること（本項の(2)参照）。必要に応じアトロピン硫酸塩、ドブタミン塩酸塩、イソプレナリン塩酸塩、アドレナリン等を使用すること。なお、肝機能、腎機能、血液像等に注意すること。
　(2)**狭心症などの虚血性心疾患を有する患者**において､本剤の投与を急に中止した場合、狭心症発作の頻発・悪化、まれに心筋梗塞及び短時間に過度の突然の血圧上昇を起こす可能性があるので、**中止を要する場合は原則として１～２週間かけて段階的に減量**し、観察を十分に行うこと。虚血性心疾患以外の患者についても同様の注意をすること（特に高齢者）。また、患者に医師の指示なしに服薬を中止しないよう説明すること。
　(3)手術前48時間は投与しないことが望ましい。
　(4)甲状腺中毒症の患者では急に投与を中止すると、症状を悪化させることがあるので中止を要する場合は原則として１～２週間かけて段階的に減量し、観察を十分に行うこと。
　(5)めまい・ふらつきがあらわれることがあるので、本剤投与中の患者（特に投与初期や増量時）には、自動車の運転等危険を伴う機械の作業をしないように注意させること。
　(6)心不全を合併する頻脈性心房細動患者では本剤投与により心不全を悪化させる可能性があるので、臨床症状に注意し、心機能検査（脈拍、血圧、心電図、X線等）を行う等、観察を十分に行うこと。
　(7)**慢性心不全の場合**
　　1)**重症慢性心不全患者**に対する本剤の投与は特に慎重な管理を要するので、本剤の**投与初期及び増量時は入院下で行う**こと。
　　2)左室収縮機能障害の原因解明に努めること。可逆的な左室収縮機能障害については、原因除去あるいは他の治療も考慮すること。

3.相互作用

併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
交感神経系に対し抑制的に作用する他の薬剤 レセルピン等	交感神経系に対し、過剰の抑制をきたすことがある。 用量を調節する。	相互に交感神経抑制作用を増強すると考えられている。
血糖降下薬	血糖降下作用が増強されることがある。	非選択性β遮断薬はカテコールアミンと競合的に拮抗することにより、肝臓での糖新生を抑制すると考えられている。
カルシウム拮抗薬 ベラパミル塩酸塩等	相互に作用が増強され、心不全や低血圧を引き起こすことがある。	相互に心収縮力・刺激伝導系の抑制作用、血圧低下作用を増強すると考えられている。
※ ヒドララジン塩酸塩	本剤の作用が増強されるおそれがある。	ヒドララジン塩酸塩により、本剤の肝初回通過効果が減少し、血中濃度が上昇する可能性がある。
※ クロニジン塩酸塩	クロニジン塩酸塩中止後のリバウンド現象を増強する可能性がある。クロニジン塩酸塩から本剤へ変更する場合、クロニジン塩酸塩を中止した数日後から本剤を投与する。また、本剤中止後数日間はクロニジン塩酸塩を中止しない。	クロニジン塩酸塩中止により末梢でのノルアドレナリン遊離が増加するが、β遮断薬併用の場合、ノルアドレナリンの作用のうち、α刺激作用が優位になり、急激な血圧上昇を起こすと考えられている。
※ クラスⅠ抗不整脈薬 ジソピラミド、プロカインアミド塩酸塩等	過度の心機能抑制作用があらわれることがある。 用量を調節する。	相互に心機能抑制作用を増強すると考えられている。
※ アミオダロン塩酸塩	心刺激伝導抑制障害（徐脈、心停止等）があらわれるおそれがある。定期的な心電図モニターを実施する。	アミオダロン塩酸塩により、本剤の肝初回通過効果が減少し、血中濃度が上昇する可能性がある。
シクロスポリン	シクロスポリンの血中濃度が上昇するおそれがある。 用量を調節する。	機序不明
リファンピシン	本剤の作用が減弱されるおそれがある。	リファンピシンにより、薬物代謝酵素P450（主にCYP3A4）が誘導され、本剤の代謝が亢進し、血中濃度が低下すると考えられている。
シメチジン ※ 選択的セロトニン再取り込み阻害剤 パロキセチン塩酸塩等	本剤の作用が増強されるおそれがある。	これらの薬剤により、薬物代謝酵素P450が阻害され、本剤の代謝が抑制される結果、血中濃度が上昇すると考えられている。
ジギタリス製剤 ジゴキシン等	心刺激伝導抑制障害（徐脈、房室ブロック等）があらわれるおそれがある。ジギタリスの濃度が上昇し、中毒症状が発現する可能性もある。 用量を調節する。	相互に刺激伝導抑制作用を増強する可能性がある。 また、ジギタリスの生物学的利用率が上昇し、血中濃度が上昇すると考えられている。
利尿降圧剤	降圧作用が増強することがある。 併用する場合は用量に注意する。	相加的に降圧作用を増強させる。
※ 交感神経刺激剤 アドレナリン等	血圧上昇があらわれることがある。	本剤のβ遮断作用により、α刺激作用が優位になると考えられている。
※ 非ステロイド性消炎鎮痛剤	本剤の降圧作用が減弱するおそれがある。	非ステロイド性消炎鎮痛剤は、血管拡張作用を有するプロスタグランジンの合成・遊離を阻害する。

4.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。

⑴重大な副作用（頻度不明）

1) 下記の重大な循環器系の副作用があらわれることがあるので、心機能検査（脈拍、血圧、心電図、X線等）を定期的に行い、このような症状があらわれた場合には減量又は投与を中止し、適切な処置を行うこと。

①高度な徐脈
②ショック
③完全房室ブロック
④心不全
⑤心停止

2) **肝機能障害、黄疸**：AST（GOT）、ALT（GPT）、γ-GTP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) **急性腎不全**：急性腎不全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。

4) **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）**：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群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。

5) **アナフィラキシー**：アナフィラキシー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。

⑵その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

1)本態性高血圧症、腎実質性高血圧症、狭心症、頻脈性心房細動

	頻度不明
過敏症	発疹、そう痒感等
循環器	徐脈、低血圧、動悸、頻脈、心房細動、期外収縮、脚ブロック、血圧上昇、心胸比増大、顔面潮紅、四肢冷感、房室ブロック、狭心症
呼吸器	喘息様症状、咳嗽、呼吸困難、息切れ、鼻閉
※※ 精神神経系	めまい、眠気、頭痛、失神、不眠、抑うつ、注意力低下、異常感覚（四肢のしびれ感等）、幻覚
消化器	悪心、胃部不快感、嘔吐、便秘、下痢、食欲不振、腹痛
代謝	血糖値上昇、尿酸上昇、CK（CPK）上昇、総コレステロール上昇、ALP上昇、LDH上昇、低血糖、尿糖、トリグリセリド上昇、カリウム上昇、糖尿病悪化、カリウム低下、ナトリウム低下
肝臓	AST（GOT）上昇、ALT（GPT）上昇等
腎臓・泌尿器	腎機能障害（BUN上昇、クレアチニン上昇等）、尿失禁、頻尿、蛋白尿
血液	貧血、白血球減少、血小板減少
眼	霧視、涙液分泌減少
その他	浮腫、脱力感、倦怠感、勃起不全、耳鳴、疲労感、胸痛、疼痛、発汗、口渇

2)慢性心不全

	頻度不明
過敏症	そう痒感、発疹等
循環器	徐脈、動悸、頻脈、心房細動、期外収縮、房室ブロック、脚ブロック、低血圧、血圧上昇、四肢冷感、心胸比増大、狭心症、顔面潮紅
呼吸器	喘息様症状、呼吸困難、息切れ、咳嗽、鼻閉
※※ 精神神経系	めまい、不眠、頭痛、眠気、注意力低下、失神、抑うつ、異常感覚（四肢のしびれ感等）、幻覚
消化器	悪心、胃部不快感、便秘、下痢、食欲不振、腹痛、嘔吐
代謝	血糖値上昇、尿糖、LDH上昇、総コレステロール上昇、CK（CPK）上昇、糖尿病悪化、ALP上昇、尿酸上昇、カリウム上昇、ナトリウム低下、カリウム低下、低血糖、トリグリセリド上昇
肝臓	AST（GOT）上昇、ALT（GPT）上昇等
腎臓・泌尿器	腎機能障害（BUN上昇、クレアチニン上昇等）、蛋白尿、尿失禁、頻尿
血液	貧血、血小板減少、白血球減少
眼	霧視、涙液分泌減少
その他	浮腫、倦怠感、疲労感、胸痛、耳鳴、脱力感、勃起不全、疼痛、発汗、口渇

5.高齢者への投与

本剤は主として肝臓で代謝される薬剤であり、重篤な肝機能障害患者で血中濃度の上昇が認められている。高齢者では肝機能が低下していることが多いため血中濃度が上昇するおそれがあり、また過度な降圧は好ましくないとされている（脳梗塞等が起こるおそれがある）ことから、高齢者に使用する場合は低用量から投与を開始するなど、患者の状態を十分観察しながら慎重に投与することが望ましい。

特に高齢の重症慢性心不全患者では、本剤の副作用が生じやすいので注意すること。

6.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投与しないこと。［妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、ラットにおける妊娠前及び妊娠初期投与試験において、臨床用量の約900倍（300mg／kg）で黄体数の減少及び骨格異常（13肋骨の短小）の増加が報告されている。］

(2)授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。［動物実験（ラット）で乳汁中に移行することが報告されている。］

7.小児等への投与

小児等に対する安全性及び有効性は確立していない（低出生体重児、新生児には使用経験がない。乳児、幼児及び小児には使用経験が少ない）。重症心不全を有する幼児及び小児において、本剤の投与により重篤な低血糖症状があらわれ、死亡に至った例も報告されている。

8.過量投与

症状：過量投与により、重症低血圧、徐脈、心不全、心原性ショック、心停止に至るおそれがある。また、呼吸器障害、気管支痙攣、嘔吐、意識障害、全身の痙攣発作をきたすおそれがある。

処置：過量投与の場合は、本剤を中止し、必要に応じて胃洗浄等により薬剤の除去を行うとともに、次のような処置を行う。なお、本剤は血液透析により除去されにくい。

※(1)過度の徐脈：アトロピン硫酸塩、イソプレナリン塩酸塩等の投与や心臓ペーシングを適用する。

(2)心不全、低血圧：強心薬、昇圧薬、輸液等の投与や補助循環を適用する。

※(3)気管支痙攣：β_2刺激薬又はアミノフィリンを静注する。

(4)痙攣発作：ジアゼパムを徐々に静注する。

9.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)カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」[1)]

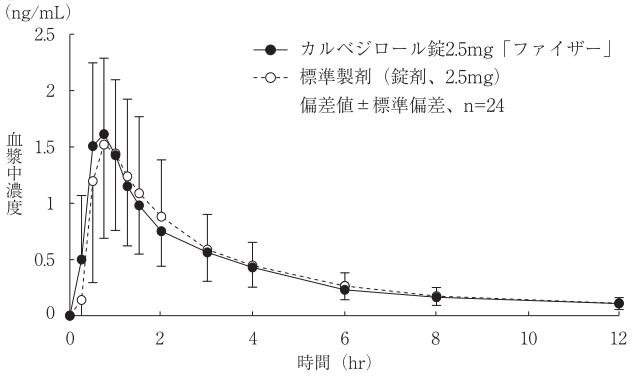
カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成24年２月29日薬食審査発0229第10号）」に基づき、カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

(2)カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」[2)]

健康成人男子にカルベジロール錠2.5mg「ファイザー」と標準製剤のそれぞれ１錠（カルベジロールとして2.5mg）を、絶食時単回経口投与して血漿中カルベジロール*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）～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（クロスオーバー法）。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}12}$（ng・hr/mL）	C_{max}（ng/mL）	T_{max}（hr）	$T_{1/2}$（hr）
カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」	4.76±1.66	1.84±0.72	0.80±0.51	4.52±1.52
標準製剤（錠剤、2.5mg）	4.94±2.09	1.91±0.86	0.91±0.45	4.61±1.08

（平均値±標準偏差、n＝24）



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。

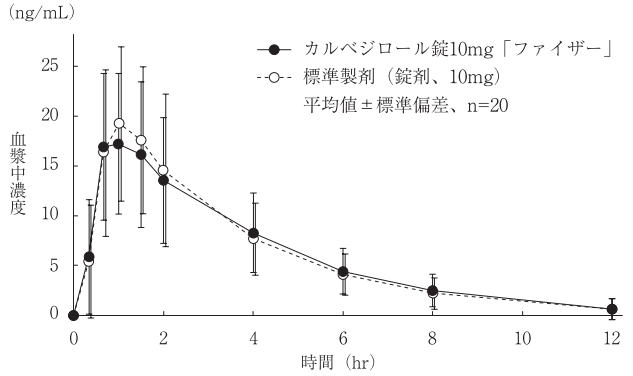
＊：本結果はS体を測定した。

(3)カルベジロール錠10mg「ファイザー」[3)]

健康成人男子にカルベジロール錠10mg「ファイザー」と標準製剤のそれぞれ１錠（カルベジロールとして10mg）を、絶食時単回経口投与して血漿中カルベジロール濃度を測定し、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）～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（クロスオーバー法）。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}12}$（ng・hr/mL）	C_{max}（ng/mL）	T_{max}（hr）	$T_{1/2}$（hr）
カルベジロール錠10mg「ファイザー」	73.87±32.32	20.72±6.79	1.05±0.43	3.06±1.06
標準製剤（錠剤、10mg）	73.36±32.39	21.39±8.25	1.07±0.48	3.03±0.97

（平均値±標準偏差、n＝20）



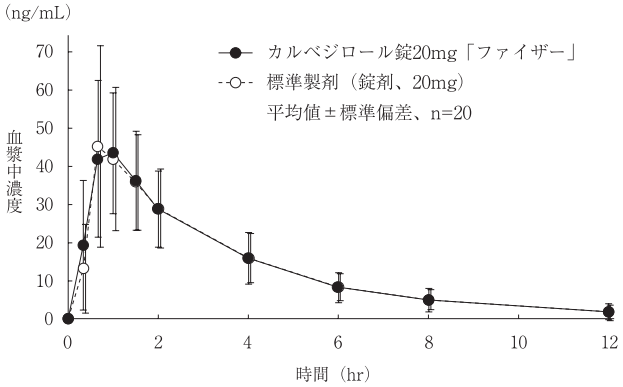
血漿中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(4)カルベジロール錠20mg「ファイザー」[4)]

健康成人男子にカルベジロール錠20mg「ファイザー」と標準製剤のそれぞれ１錠（カルベジロールとして20mg）を、絶食時単回経口投与して血漿中カルベジロール濃度を測定し、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）～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（クロスオーバー法）。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}12}$（ng・hr/mL）	C_{max}（ng/mL）	T_{max}（hr）	$T_{1/2}$（hr）
カルベジロール錠20mg「ファイザー」	159.72±62.41	47.24±17.69	0.89±0.30	3.02±1.07
標準製剤（錠剤、20mg）	158.85±58.66	51.96±21.34	0.93±0.40	3.09±0.81

（平均値±標準偏差、n＝20）



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。

2.溶出挙動[1,5~7]

カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」、カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」、カルベジロール錠10mg「ファイザー」及びカルベジロール錠20mg「ファイザー」は、日本薬局方医薬品各条に定められたカルベジロール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】

交感神経α及びβ受容体に拮抗作用を示す薬物であるが、主体はβ遮断作用で、降圧作用も主としてこれに基づく（プロプラノロール）。β遮断薬投与により内因性カテコールアミンのα作用が強まり血管収縮が起こることがあるので、これを抑制するためにα遮断作用を付加した薬物である[8]。

【有効成分に関する理化学的知見】

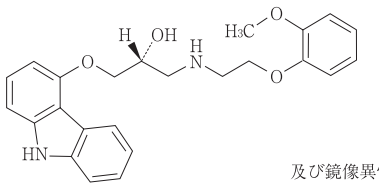
一般名：カルベジロール（Carvedilol）

化学名：(2*RS*)-1-(9*H*-Carbazol-4-yloxy)-3-{[2-(2-methoxyphenoxy) ethyl]amino} propan-2-ol

分子式：$C_{24}H_{26}N_2O_4$

分子量：406.47

構造式：



及び鏡像異性体

性　状：白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。
酢酸（100）に溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール（99.5）に溶けにくく、水にほとんど溶けない。
メタノール溶液（1→100）は旋光性を示さない。

融　点：114～119℃

【取扱い上の注意】

安定性試験[9~12]

加速試験（40℃、相対湿度75％、6ヵ月）の結果、カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」、カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」、カルベジロール錠10mg「ファイザー」及びカルベジロール錠20mg「ファイザー」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】

カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」：100錠（PTP）
カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」：100錠（PTP）
カルベジロール錠10mg「ファイザー」：100錠（PTP）
カルベジロール錠20mg「ファイザー」：100錠（PTP）

【主要文献】

1)社内資料：溶出試験（カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」）
[L20151106098]
2)社内資料：生物学的同等性試験（カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」）
[L20151106099]
3)社内資料：生物学的同等性試験（カルベジロール錠10mg「ファイザー」）
[L20120113027]
4)社内資料：生物学的同等性試験（カルベジロール錠20mg「ファイザー」）
[L20120113031]
5)社内資料：溶出試験（カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」）
[L20151106101]
6)社内資料：溶出試験（カルベジロール錠10mg「ファイザー」）[L20120113026]
7)社内資料：溶出試験（カルベジロール錠20mg「ファイザー」）[L20120113030]
8)第十七改正　日本薬局方解説書　廣川書店：C-1318, 2016
9)社内資料：安定性試験（加速試験）（カルベジロール錠1.25mg「ファイザー」）
[L20151106097]
10)社内資料：安定性試験（加速試験）（カルベジロール錠2.5mg「ファイザー」）
[L20151106100]
11)社内資料：安定性試験（加速試験）（カルベジロール錠10mg「ファイザー」）
[L20120113028]
12)社内資料：安定性試験（加速試験）（カルベジロール錠20mg「ファイザー」）
[L20120113032]

【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。

ファイザー株式会社　製品情報センター
〒151-8589　東京都渋谷区代々木3-22-7
学術情報ダイヤル　0120-664-467
FAX　03-3379-3053

【製造販売】
ファイザー株式会社
東京都渋谷区代々木3-22-7
【提携】
マイラン製薬株式会社
大阪市中央区本町2丁目6番8号

014