

貯 法：室温保存

有効期間：3年

承認番号 22000AMX02036

販売開始 1998年10月

MUODSeL01

気道潤滑去痰剤

アンブロキシソール塩酸塩製剤

ムコサル®ドライシロップ1.5%

Mucosal® Dry Syrup

Mucosal®
sanofi

2. 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

3. 組成・性状

3.1 組成

成分・含量	1g中アンブロキシソール塩酸塩15mg
添 加 剤	エリスリトール、ヒドロキシプロピルセルロース、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、グリチルリチン酸モノアンモニウム、フマル酸一ナトリウム、安息香酸ナトリウム、香料（ヨーグルトフレーバー）、含水二酸化ケイ素

3.2 製剤の性状

剤 形	ドライシロップ剤
性 状	白色～微黄色の粒状または粉末
に お い	ヨーグルトようのにおい
味	味は甘い

4. 効能又は効果

下記疾患の去痰

急性気管支炎、気管支喘息

6. 用法及び用量

通常、幼・小児に1日0.06g/kg（アンブロキシソール塩酸塩として0.9mg/kg）を3回に分け、用時溶解して経口投与する。

なお、年齢・症状により適宜増減する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

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。動物実験（ラット）で母乳中へ移行することが報告されている。

9.7 小児等

低出生体重児及び新生児を対象とした臨床試験は実施していない。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

発疹、顔面浮腫、呼吸困難、血圧低下等があらわれることがある。

11.1.2 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）（頻度不明）

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	胃不快感	胃痛、腹部膨満感、腹痛、下痢、嘔気、嘔吐、便秘、食思不振、消化不良（胃部膨満感、胸やけ等）	
過 敏 症		発疹、蕁麻疹、蕁麻疹様紅斑、そう痒	血管浮腫（顔面浮腫、眼瞼浮腫、口唇浮腫等）
肝 臓		肝機能障害（AST上昇、ALT上昇等）	
そ の 他		口内しびれ感、上肢のしびれ感	めまい

注）発現頻度は錠、液、シロップ及び徐放カプセルの承認時までの臨床試験及び使用成績調査を含む。

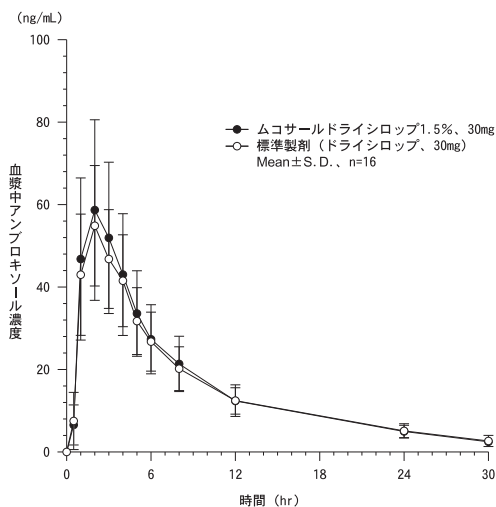
16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人男子16名に本剤2g（アンブロキシソール塩酸塩として30mg）^{注1）}を経口投与した時の平均血漿中濃度は、投与約2時間後に最高値60.3ng/mLに達したのち、漸減し、投与30時間後には最高値の約1/20となった^{1）}。

16.1.2 生物学的同等性試験

ムコサルドライシロップ1.5%と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2g（アンブロキシソール塩酸塩として30mg）^{注1）}健康成人男子16名に空腹時単回経口投与して血漿中アンブロキシソール濃度を測定し、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^{1）}。

	判定パラメータ	
	AUC (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)
ムコサルドライシロップ 1.5%、30mg	482.1±157.9	60.3±22.1
標準製剤 (ドライシロップ、30mg)	463.6±111.8	56.4±13.5

(Mean±S.D., n=16)

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。

注) 本剤の承認用量は幼・小児に1日0.06g/kg(アンブロキシソール塩酸塩として0.9mg/kg)である。

16.8 その他

16.8.1 溶出挙動

ムコサルドライシロップ1.5%は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたアンブロキシソール塩酸塩ドライシロップの溶出規格に適合していることが確認されている²⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

気道、肺においてアンブロキシソールは、気道粘膜組織機能を亢進させて、気道液量を増加させるとともに粘液の粘度を低下させ、更に線毛運動の亢進及び肺表面活性物質(肺サーファクタント)の分泌促進により、これらが総合的に作用して粘液の移動を容易にさせ、気道壁の潤滑化と相乗して喀痰喀出効果を高める。

18.2 喀痰喀出効果

- ・肺表面活性物質の分泌促進作用^{3~9)}(正常ラット、レセルピン処理ラット、未熟ウサギ胎児、病態マウス、珪肺症患者)
- ・気道液の分泌促進作用^{5,10,11)}(病態ウサギ、正常ウサギ)
- ・線毛運動亢進作用^{10,11)}(正常ハト、病態ウサギ)

これらが総合的に作用して喀痰喀出効果を示すものと考えられる。この際、肺表面活性物質の役割としては、線毛の存在しない肺胞や呼吸細気管支を含め気道中の粘性物質を排出しやすくするものと考えられている¹¹⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：アンブロキシソール塩酸塩

(Ambroxol Hydrochloride)

化学名：*trans*-4-[(2-amino-3,5-dibromobenzyl)amino]cyclohexanol hydrochloride

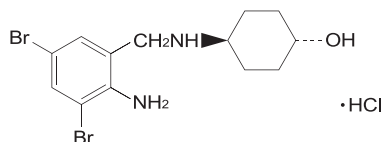
分子式：C₁₃H₁₈Br₂N₂O·HCl

分子量：414.56

性状：白色の結晶性の粉末で、においはなく、わずかに特異な味がある。

メタノールにやや溶けやすく、水又はエタノール(99.5)にやや溶けにくく、酢酸(100)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

化学構造式：



融点：約235℃(分解)

20. 取扱い上の注意

外箱開封後は、湿気を避けて遮光して保存すること。

22. 包装

100g [瓶、乾燥剤入り]

500g [瓶、乾燥剤入り]

23. 主要文献

- 1) 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 社内資料：溶出試験
- 3) 社内資料：肺表面活性物質の生合成および分泌促進作用(第1報)
- 4) 社内資料：肺表面活性物質の生合成および分泌促進作用(第2報)
- 5) 宮田 健 他：日薬理誌. 1986;88:57-64
- 6) 千田勝一 他：薬理と治療. 1981;9(2):483-6
- 7) Curti P C：Pneumologie. 1972;147(1):62-74
- 8) 前多治雄 他：薬理と治療. 1981;9(2):487-90
- 9) Curti P C, et al.：Arzneim-Forsch. 1978;28(5a):922-5
- 10) 社内資料：気道(粘)液及び線毛運動に対する作用
- 11) 長岡 滋 他：薬理と治療. 1981;9(5):1845-54

24. 文献請求先及び問い合わせ先

サノフィ株式会社

コールセンター くすり相談室

〒163-1488 東京都新宿区西新宿三丁目20番2号

フリーダイヤル 0120-109-905

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

サノフィ株式会社

〒163-1488 東京都新宿区西新宿三丁目20番2号