＊＊2008年12月改訂（第８版）
＊2007年10月改訂

貯法	気密容器、遮光保存 開封後湿気に注意
使用期限	外箱、容器に使用期限を表示

日本標準商品分類番号
872239

＊＊	承認番号	22000AMX02036000
＊＊	薬価収載	2008年12月
	販売開始	1998年10月

気道潤滑去痰剤

＊＊ムコサール®ドライシロップ1.5%
Mucosal® Dry Syrup 1.5%

（アンブロキソール塩酸塩製剤）

Boehringer Ingelheim

®＝登録商標

【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	ムコサールドライシロップ1.5%
	成分・含量	1g中アンブロキソール塩酸塩15mg
	添加物	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
	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

【効能・効果】
下記疾患の去痰
急性気管支炎、気管支喘息

【用法・用量】
通常、幼・小児に１日0.06g/kg(アンブロキ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。

【使用上の注意】
１．副作用
(1)重大な副作用
1)ショック、アナフィラキシー様症状(頻度不明)：ショック、アナフィラキシー様症状(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)皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)(頻度不明)：皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson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。

(2)その他の副作用
以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	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)	
過敏症注)		発疹、蕁麻疹、蕁麻疹様紅斑、瘙痒	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(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇等〕	
その他		口内しびれ感、上肢のしびれ感	めまい

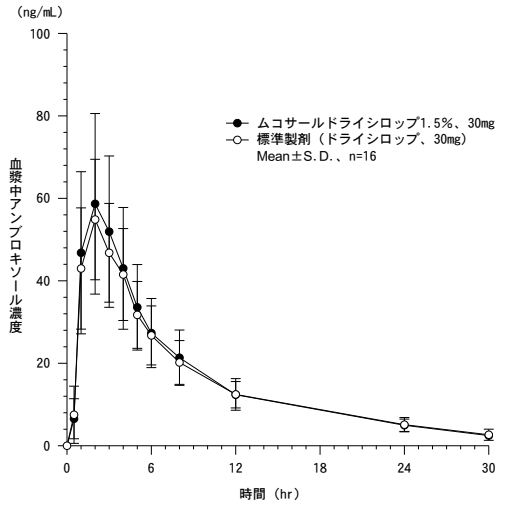
注)発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

２．妊婦、産婦、授乳婦等への投与
本剤は小児用製剤である。
(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)授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。
［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。］

３．小児等への投与
低出生体重児及び新生児に対する安全性は確立していない。

【薬物動態】
１．血漿中濃度
健康成人男子16名に本剤２g(アンブロキソール塩酸塩として30mg)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)]

２．生物学的同等性試験
ムコサールドライシロップ1.5％と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ２g(アンブロキソール塩酸塩として30mg)健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中アンブロキソール濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)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[2)]。



	判定パラメータ	
	AUC(ng･hr/mL)	Cmax(ng/mL)
ムコサールドライシロップ	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、Cmax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。

3．溶出挙動

ムコサールドライシロップ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。[3)]

【薬効薬理】

1．肺表面活性物質の分泌促進作用(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)[4)～10)]

2．気道液の分泌促進作用(病態ウサギ、正常ウサギ)[11)]

3．線毛運動亢進作用(正常ハト、病態ウサギ)[4),11)]

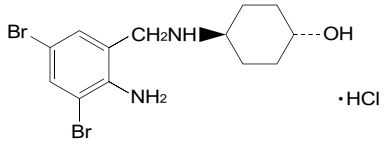
これらが総合的に作用して喀痰喀出効果を示すものと考えられる。この際、肺表面活性物質の役割としては、線毛の存在しない肺胞や呼吸細気管支を含め気道中の粘性物質を排出しやすくするものと考えられている。[4)]

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アンブロキソール塩酸塩(JAN)
Ambroxol Hydrochloride(JAN)
Ambroxol(INN)

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

化学構造式：



分子式：$C_{13}H_{18}Br_2N_2O$・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。

融　点：約235℃(分解)

【取扱い上の注意】

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カ月)の結果、ムコサールドライシロップ1.5%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。[12)]

**【包　　装】

ムコサールドライシロップ1.5%：100g 瓶
500g 瓶

【主要文献】

1）長倉明人ほか：日本ベーリンガーインゲルハイム社 川西医薬研究所報告,1996
2）長倉明人ほか：日本ベーリンガーインゲルハイム社 川西医薬研究所報告,1996
3）日本ベーリンガーインゲルハイム社 社内資料
4）長岡　滋、加瀬佳年：薬理と治療 **9**(5)：1845,1981
5）田辺裕史ほか：帝人㈱生物医学研究所報告(第１報),1981
6）田辺裕史ほか：帝人㈱生物医学研究所報告(第２報),1981
7）千田勝一ほか：薬理と治療 **9**(2)：483,1981
8）前多治雄ほか：薬理と治療 **9**(2)：487,1981
9）Curti P C：Pneumonologie **147**(1)：62,1972
10）Curti P C et al：Arzneim-Forsch **28**(5a)：922,1978
11）加瀬佳年ほか：熊本大学薬学部研究報告,1980
12）日本ベーリンガーインゲルハイム社 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。

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社
DIセンター
〒141-6017 東京都品川区大崎２丁目１番１号
ThinkPark Tower
フリーダイヤル：0120-189-779
(受付時間) 9:00～18:00
(土・日・祝日・弊社休業日を除く)

製造販売
*日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社
東京都品川区大崎2丁目1番1号

08-62 ①②

0568