

貯法：室温保存
有効期間：3年小児用ムコソルバン®シロップ0.3%
Mucosolvan®Syrup 0.3% for Pediatric

承認番号	22100AMX01490000
販売開始	1989年11月

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

販売名	小児用ムコソルバンシロップ0.3%	
有効成分	名称	アンブロキシソール塩酸塩
	含量 (1mL中)	3.0mg
添加剤	酒石酸 ヒドロキシエチルセルロース D-ソルビトール グリセリン ピロ亜硫酸ナトリウム エタノール 安息香酸 香料(ラズベリーフレーバー)	

3.2 製剤の性状

販売名	小児用ムコソルバンシロップ0.3%
剤形	シロップ剤
pH	2.3~3.3
色調・性状	無色~微黄色澄明の液で、果実様の香気があり味は甘い

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0.3mL/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

種類	頻度	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。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

抗生物質を含有するシロップ用細粒との混合により、外観(色、にごり)変化の起こることがあるので、これらの薬剤との併用を必要とする場合には別々に投与すること。

16. 薬物動態

16.2 吸収

患児に本剤を単回経口投与したとき、健康成人男子にアンブロキシソール塩酸塩錠15mg^(註)を単回経口投与したときの場合と同様、消化管から速やかかつ良好に吸収された。血漿中の未変化体濃度は投与後2~4時間でピークに達し半減期は約3時間であり、その後比較的速やかに減少した^{(1)~(3)}。

16.4 代謝

患児に本剤を投与後、尿中には未変化体、未変化体のβ-グルクロン酸抱合体及びN-脱アルキル化代謝物が認められた。また、ホルミル化閉環代謝物が微量検出された^{(2)~(4)}。

成人においても代謝は小児と同じであった⁽⁴⁾。

16.5 排泄

患児に本剤を0.3mg/kg投与後24時間までの未変化体及び抱合体の尿中排泄率は19.1%であった⁽⁴⁾。なお、健康成人男子にアンブロキシソール塩酸塩錠15mg^(註)を経口投与すると、投与後72時間までに50~70%が尿中に排泄された^{(2),(3)}。

注)本剤の承認用量は幼・小児に1日0.3mL/kg(アンブロキシソール塩酸塩として0.9mg/kg)である。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

国内延べ14施設で実施された比較試験を含む臨床試験の効果判定症例211例における有効率は下記のとおりであった⁵⁾。

疾患名	有効率(%)	有効以上
急性気管支炎		64.3%(45/70)
気管支喘息		58.2%(82/141)

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

アンブロキシール塩酸塩は、肺表面活性物質の分泌促進作用、気道液の分泌促進作用、線毛運動亢進作用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^{6)~13)}。

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

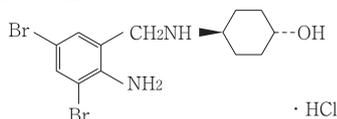
分子量

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

本剤は、低温下で添加剤の結晶が析出することがあるので、保管に際しては注意すること。

22. 包装

500mL(褐色ガラス瓶入り)

23. 主要文献

- 1) 馬場 実ほか.: 同愛記念病院ほか報告(未発表): 薬物動態(小児入院患者). 1987.
- 2) 関 隆ほか.: 臨床薬理. 1977; 8(1): 25-31.
- 3) 日本ベーリンガーインゲルハイム(株)社内報告: 薬物動態(健康成人). 1981.
- 4) 日本ベーリンガーインゲルハイム(株)社内報告: 薬物動態(小児入院患者、健康成人). 1988.
- 5) 三河春樹ほか.: 薬理と治療. 1987; 15(6): 2691-700.
- 6) 長岡 滋ほか.: 薬理と治療. 1981; 9(5): 1845-54.
- 7) 社内報告: 肺表面活性物質の分泌促進作用(ラット). 1981.

- 8) 社内報告: 肺表面活性物質の分泌促進作用(ラット、用量相関性). 1981.
- 9) 千田勝一ほか.: 薬理と治療. 1981; 9(2): 483-6.
- 10) 前多治雄ほか.: 薬理と治療. 1981; 9(2): 487-90.
- 11) Curti PC.: Pneumonologie. 1972; 147(1): 62-74.
- 12) Curti PC, et al.: Arzneim-Forsch. 1978; 28(5a): 922-5.
- 13) 加瀬佳年ほか.: 熊本大学薬学部報告(未発表): 気道液分泌促進作用(ウサギ)、線毛運動亢進作用(ハト), 1980.

24. 文献請求先及び問い合わせ先

帝人ファーマ株式会社 メディカル情報グループ
〒100-8585 東京都千代田区霞が関3丁目2番1号
フリーダイヤル 0120-189-315

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

帝人ファーマ株式会社

東京都千代田区霞が関3丁目2番1号

26.2 提携

sanofi