

\*\*2017年7月改訂 (第10版)  
\*2008年12月改訂

貯 法：気密容器  
使用期限：外箱、容器に使用期限を表示

徐放性 気道潤滑去痰剤

# \*ムコサル®-Lカプセル45mg

## Mucosal®

®=登録商標

アンブロキシール塩酸塩製剤

日本標準商品分類番号

8 7 2 2 3 9

|        |               |
|--------|---------------|
| * 承認番号 | 22000AMX02350 |
| * 薬価収載 | 2008年12月      |
| 販売開始   | 1996年11月      |
| 再審査結果  | 2004年9月       |


0717-12301 D9026401

SANOFI

### 【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    | ムコサル-Lカプセル45mg  |
| 成分・含量    | 1カプセル中アンブロキシール塩酸塩 45mg  |
| 添加物      | 精製白糖、トウモロコシデンプン、ポビドン、ヒドロキシプロピルセルロース、その他4成分<br>カプセル本体にカラギーナン、塩化カリウム、酸化チタン、黄色三酸化鉄、ジメチルポリシロキサン、ソルビタン脂肪酸エステル、ヒプロメロースを含有する |
| 剤形       | 淡黄色の硬カプセル剤  |
| 内容物      | 白色～帯黄白色の粒   |
| ** 外形    | 2号                                   |
| 長さ       | 約18mm   |
| 直径       | 約6mm  |
| 重さ       | 約0.28g  |
| ** 識別コード | sa 203  |

### 【効能又は効果】

下記疾患の去痰

急性気管支炎、気管支喘息、慢性気管支炎、気管支拡張症、肺結核、塵肺症、手術後の喀痰喀出困難

### 【用法及び用量】

通常、成人には1回1カプセル (アンブロキシール塩酸塩として45mg) を1日1回経口投与する。

### 【使用上の注意】

#### 1. 副作用

承認時及びその後の使用成績調査での安全性評価対象4,713例中60例 (1.3%) に69件の副作用 (臨床検査値の異常変動を含む) が認められた。主な副作用は、胃不快感9件 (0.2%)、嘔気7件 (0.2%) 等であった。

なお、本剤及び帝人(株)集計によるムコソルバン錠、液及びシロップを併せた総症例33,196例中副作用 (臨床検査値の異常変動を含む) が報告されたのは221例 (0.7%) であり、主な副作用は、胃不快感34件 (0.1%)、嘔気27件 (0.08%) 等の消化器症状で、副作用全体の約60%であった (全剤形共に、承認時及び再審査終了時までの集計)。

#### (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 <sup>注)</sup> |          | 発疹、蕁麻疹、蕁麻疹様紅斑、痒痒                               | 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. 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ので注意すること。なお、減量が必要な場合には、錠剤等他の剤形を使用すること。

#### 3. 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。]

#### 4. 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、更には穿孔をお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。]

#### 5. その他の注意

早朝覚醒時に喀痰喀出困難を訴える患者には、夕食後投与が有用である。

## 【薬物動態】

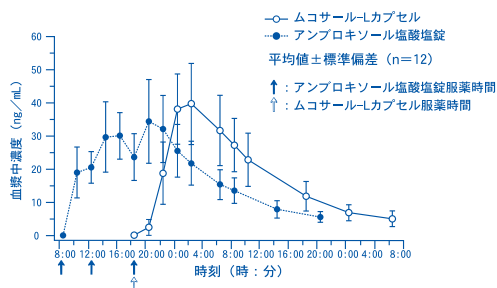
### 1. 吸収

健康成人男子に対し単回経口投与したとき、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6～8時間でピークに到達し半減期は10～11時間であり、その後比較的速やかに減少した。<sup>1)</sup>

連続的に5日間経口投与したときの血漿中未変化体濃度の推移は、単回投与の場合とほぼ一致し、連続投与によっても血漿薬物動態の変化は認められなかった。<sup>2)</sup>

### 2. 血中濃度（錠との比較）

健康成人男子にムコサル-Lカプセル1カプセル(45mg)を経口投与し、クロスオーバー法によりアンブロキソール塩酸塩錠1回1錠(15mg)、1日3回(45mg/日)投与との比較が行われた。ムコサル-Lカプセルの単回投与では血漿中濃度に持続性が認められ、アンブロキソール塩酸塩錠1日3回投与とほぼ同等の血中薬物動態を示した。<sup>3)</sup> また、ムコサル-Lカプセルを1日1回夕食後服用時では、翌朝の血漿中濃度はアンブロキソール塩酸塩錠に比較し有意に高いことが示された。<sup>1)</sup>



### 3. 排泄

健康成人男子に対し単回経口投与したとき、投与後36時間までに尿中へ未変化体が5.34%排泄された。<sup>3)</sup>

## 【臨床成績】

(1)国内延べ139施設で、総計421例について実施された二重盲検比較試験<sup>4-5)</sup>を含めた臨床試験の有効率は65.3%であった。各疾患別の有効率は下表のとおりであった。

| 投与対象       | 有効例数/効果判定例数 | 有効率(中等度改善以上) |
|------------|-------------|--------------|
| 急性気管支炎     | 39/ 50      | 78.0%        |
| 気管支喘息      | 42/ 65      | 64.6%        |
| 慢性気管支炎     | 84/126      | 66.7%        |
| 気管支拡張症     | 20/ 31      | 64.5%        |
| 肺結核        | 40/ 60      | 66.7%        |
| 塵肺症        | 24/ 47      | 51.1%        |
| 手術後の喀痰咯出困難 | 26/ 42      | 61.9%        |
| 計          | 275/421     | 65.3%        |

(2)早朝覚醒時に喀痰咯出困難を訴える患者を対象に行った二重盲検比較試験<sup>5)</sup>で、本剤の夕食後1回投与の有効性が認められた。

## 【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)<sup>6-12)</sup>
2. 気道液の分泌促進作用(病態ウサギ、正常ウサギ)<sup>13)</sup>

### 3. 線毛運動亢進作用(正常ハト、病態ウサギ)<sup>6,13)</sup>

これらが総合的に作用して喀痰咯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。<sup>6)</sup>

## 【有効成分に関する理化学的知見】

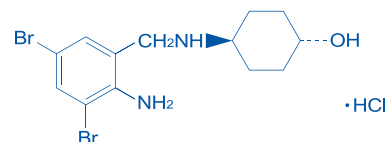
一般名: アンブロキソール塩酸塩 (JAN)

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<sub>13</sub>H<sub>18</sub>Br<sub>2</sub>N<sub>2</sub>O · 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°C (分解)

## \*【包装】

ムコサル-Lカプセル45mg:

100カプセル (10カプセル×10) PTP

500カプセル (10カプセル×50) PTP

700カプセル (14カプセル×50) PTP

## 【主要文献】

- 1) 社内資料: 帝人株式会社生物医学研究所報告, 1990①
- 2) 社内資料: 帝人株式会社生物医学研究所報告, 1990②
- 3) 社内資料: 帝人株式会社生物医学研究所報告, 1989
- 4) 原澤道美ほか: Therapeutic Research 14(1)311, 1993
- 5) 長岡 滋ほか: Therapeutic Research 14(2)617, 1993
- 6) 長岡 滋、加瀬佳年: 薬理と治療 9(5)1845, 1981
- 7) 社内資料: 帝人株式会社生物医学研究所報告(第1報), 1981
- 8) 社内資料: 帝人株式会社生物医学研究所報告(第2報), 1981
- 9) 千田勝一ほか: 薬理と治療 9(2)483, 1981
- 10) 前多治雄ほか: 薬理と治療 9(2)487, 1981
- 11) Curti P C: Pneumonologie 147(1)62, 1972
- 12) Curti P C et al: Arzneim-Forsch 28(5a)922, 1978
- 13) 社内資料: 気道(粘)液及び線毛運動に対する作用

## \*\*【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。

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 FAX (03)6301-3010

\*\*製造販売:

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