

＊ ＊ 2009 年 4 月改訂（第 7 版，販売名変更に基づく改訂）
＊ 2008 年 6 月改訂

貯 法：遮光・気密容器・室温保存（「取扱い上の注意」の項参照）
使用期限：外箱等に表示（使用期間 5 年）

シオノギ製薬

鎮咳去痰剤

メジコン®配合シロップ

デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物・
クレゾールスルホン酸カリウムシロップ
Medicon®

日本標準商品分類番号
872249

承認番号	22100AMX00720
薬価収載	2009年9月
販売開始	1956年10月
再評価結果	1981年8月

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. MAO 阻害剤投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕

【組成・性状】

1. 組成

販売名	メジコン配合シロップ
成分・含量 (1mL 中)	デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物 2.5mg クレゾールスルホン酸カリウム 15mg
添加物	エタノール，白糖，カラメル，安息香酸，水酸化ナトリウム，チェリーエッセンス

2. 性状

販売名	メジコン配合シロップ
性状・剤形	淡黄褐色澄明の粘稠な液体で，甘味，苦味及び芳香がある。（シロップ剤）
pH	3.3～4.5

【効能・効果】

下記疾患に伴う咳嗽及び喀痰咯出困難

急性気管炎，慢性気管炎，感冒・上気道炎，肺結核，百日咳

【用法・用量】

通常，成人には 1 日 18～24mL，8～14 歳 1 日 9～16mL，3 ヲ月～7 歳 1 日 3～8mL を 3～4 回に分割経口投与する。
なお，年齢，症状により適宜増減する。

【使用上の注意】＊

1. 重要な基本的注意

眠気を催すことがあるので，本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないように注意すること。

2. 相互作用

本剤は，主に肝代謝酵素 CYP2D6 で代謝される。

(1) 併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
MAO 阻害剤	臨床症状：セロトニン症候群（痙攣，ミオクローヌス，反射亢進，発汗，異常高熱，昏睡等）があらわれるとの報告がある。	デキストロメトルファンは中枢のセロトニン濃度を上昇させる。MAO 阻害剤はセロトニンの代謝を阻害し，セロトニンの濃度を上昇させる。併用によりセロトニンの濃度が更に高くなるおそれがある ¹⁾ 。

(2) 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
薬物代謝酵素（CYP2D6）を阻害する薬剤 キニジン アミオダロン テルビナフィン等	本剤の血中濃度が上昇することがある。	これらの薬剤の薬物代謝酵素（CYP2D6）阻害作用により，本剤の代謝が阻害されるため。

3. 副作用

再評価結果における国内 9 報告の安全性評価対象例 476 例中，副作用は 5 例（1.1％）に認められた。その内訳は，悪心，下痢，食欲不振，軟便，蕁麻疹各 1 例であった。

(1) 重大な副作用

- 1) 呼吸抑制（0.1％未満）：呼吸抑制があらわれることがあるので，このような場合には投与を中止し，適切な処置を行うこと。
- 2) 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（呼吸困難，蕁麻疹，血管浮腫等）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) その他の副作用

種類\頻度	5％以上又は頻度不明	0.1～5％未満	0.1％未満
過敏症 ^{注1}	発疹		
精神神経系	眠気	頭痛，眩暈	不快，不眠
消化器		悪心・嘔吐，食欲不振，便秘，軟便，下痢，腹痛	口渇，おくび

注 1：症状があらわれた場合には投与を中止すること。

4. 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減量するなど注意すること。

5. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

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。〕

6. 過量投与

徴候，症状：嘔気，嘔吐，尿閉，運動失調，錯乱，興奮，神経過敏，幻覚，呼吸抑制，嗜眠等を起こすことがある。

処置：一般的な薬物除去法（胃洗浄，活性炭投与等）により本剤を除去する。また，必要に応じて呼吸管理や対症療法を行う。ナロキソンの投与により改善したとの報告がある。

7. 適用上の注意

調剤時

- (1) ヨウ化カリウム（あるいは，ヨウ化ナトリウム）との共存は難溶性のヨウ化水素酸塩を生じ，また，炭酸水素ナトリウム，アンモニア・ウイキョウ精等と配合すると遊離の塩基を析出することがあるので，これらとの配合は避けること。
- (2) 苦味チンキ，橙皮チンキ等のチンキ剤や，溶性フェノバルビタール等との配合の場合は，濃度が増大すると沈殿を生じる傾向があるので注意すること。

【薬物動態】

1. 血中濃度

健康成人 8 例にデキストロメトルファン臭化水素酸塩シロップ（デキストロメトルファン臭化水素酸塩として 60mg，承認外用量）を単回経口投与したときの薬物動態パラメータを表 1 に示す²⁾。（外国人によるデータ）

（承認用量は 1 回 4.5～8mL，デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物として 11.25～20mg である。）

表 1 薬物動態パラメータ

投与量 (mg)	n	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)	T _{1/2} (hr)
60	8	386±107.2	2.0 (1.0-2.0)	2169±702.6	3.3±0.63

(GC/MS) (mean±S. D.)

（参考）
イヌにデキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物 15mg 及びクレゾールスルホン酸カリウム 90mg を経口投与したときのデキストロメトルファン及び 4-クレゾールスルホン酸の薬物動態パラメータ³⁾を表 2 に示す。

表 2 薬物動態パラメータ

	<i>n</i>	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	AUC (ng・hr/mL)
デキストロメトルファン	6	3.33	1.50	AUC ₀₋₇ 12.796
4-クレゾールスルホン酸	6	6050	0.75	AUC ₀₋₃ 8820 (mean)

2. 代謝
デキストロメトルファンは肝臓で大部分が代謝され、*O*-脱メチル体（デキストルファン）、*N*-脱メチル体及び *N*、*O*-脱メチル体となる。これらの代謝物はデキストロメトルファンと同等の鎮咳作用を示した⁴⁾。（外国人によるデータ）
デキストロメトルファンの肝代謝に関する CYP 分子種は、*O*-脱メチル化では CYP2D6、*N*-脱メチル化では CYP3A4 である⁵⁾。
3. 排泄
ヒトに ¹⁴C-標識デキストロメトルファンを経口投与したとき、投与後 24 時間以内の尿中及び糞中回収率は、総投与放射活性に対してそれぞれ 42.71%，0.12%であった⁴⁾。（外国人によるデータ）
4. その他
初回通過効果（デキストロメトルファン）：有（割合は不明）⁶⁾（外国人によるデータ）

【臨床成績】

再評価結果における有効性評価対象例は 85 例であり、有効率は 61.2%（52 例）であった⁷⁾。

表 3 臨床成績

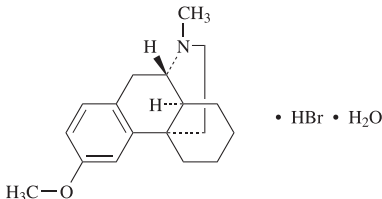
疾患名	有効例数/有効性評価対象例数	有効率（%）
急性気管支炎	4/11	36.4
慢性気管支炎	17/25	68.0
慢性細気管支炎	0/1	—
感冒	31/48	64.6
計	52/85	61.2

【薬効薬理】

- 薬理作用
1. 鎮咳作用
デキストロメトルファンは延髄にある咳中枢に直接作用し、咳反射を抑制することにより鎮咳作用を示す⁸⁾。
2. 去痰作用
クレゾールスルホン酸カリウムはウサギを用いた試験によれば気道の分泌を促進し、粘稠な喀痰を液化して去痰作用を示す⁹⁾。

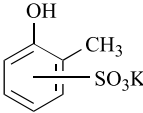
【有効成分に関する理化学的知見】

1. 一般的名称：デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物（JAN）[日局]
Dextromethorphan Hydrobromide Hydrate
化学名：(9*S*, 13*S*, 14*S*)-3-Methoxy-17-methylmorphinan monohydrobromide monohydrate
分子式：C₁₈H₂₅N₃O・HBr・H₂O
分子量：370.32
化学構造式：



性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

- メタノールに極めて溶けやすく、エタノール（95）又は酢酸（100）に溶けやすく、水にやや溶けにくい。
融点：約 126℃
分配係数：16.98 [pH7, 1-オクタノール/緩衝液]
2. 一般的名称：クレゾールスルホン酸カリウム（JAN）[局外規]
Potassium Cresolsulphonate
分子式：C₇H₇KO₄S
分子量：226.29
化学構造式：



性状：白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。
水又は酢酸に溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

光により退色するので、開封後は使用の都度密栓し、箱等に入れるか、暗所に保存すること。

【包装】

メジコン配合シロップ：瓶 500mL

【主要文献】

[文献請求番号]

- 1) Nierenberg, D. W. et al. : Clin. Pharmacol. Ther., 1993, **53**(1), 84 [199302130]
- 2) Aylward, M. et al. : Eur. J. Respir. Dis., 1984, **65**, 283 [198402875]
- 3) 社内資料（イヌでのバイオアベイラビリティ, 1976)
- 4) Willner, K. et al. : Arzneim.-Forsch., 1963, **13**, 26 [196300035]
- 5) 野口英世：薬物動態, 1995, **10**(3), 407 [199500744]
- 6) Silvasti, M. et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. Toxicol., 1987, **25**(9), 493 [198702551]
- 7) 塩野義製薬集計；加地正郎ほか：臨床と研究, 1977, **54**(9), 3009 [197700590] ほか
- 8) 谷山紘太郎ほか：NEW 薬理学（田中千賀子ほか編），2002, pp. 442-445, 南江堂，東京
- 9) 大谷弘一ほか：薬理と治療, 1977, **5**(6), 1513 [197700302]

【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。

塩野義製薬株式会社 医薬情報センター
〒541-0045 大阪市中央区道修町 3 丁目 1 番 8 号
電話 0120-956-734
FAX 06-6202-1541
<http://www.shionogi.co.jp/med/>

製造販売元

塩野義製薬株式会社

〒 541-0045 大阪市中央区道修町 3 丁目 1 番 8 号