

※※2010年10月改訂（第7版：社名変更等に伴う改訂）
※2008年4月改訂

抗ヒスタミン剤

※日本薬局方 クロルフェニラミンマレイン酸塩注射液

承認番号	16000AMZ01742000
薬価収載	1960年6月
販売開始	1956年6月
再評価結果	1975年12月

処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋
により使用すること

クロール・トリメトン®注10mg

貯法：遮光・室温保存
※※使用期間：3年
使用期限：外箱等に記載

CHLOR-TRIMETON® Injection 10mg



【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) 本剤の成分又は類似化合物に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 緑内障の患者〔抗コリン作用により眼内圧が上昇し、緑内障が増悪することがある。〕
- (3) 前立腺肥大等下部尿路に閉塞性疾患のある患者〔抗コリン作用により排尿困難、尿閉等があらわれ、症状が増悪することがある。〕
- (4) 低出生体重児・新生児（「小児等への投与」の項参照）

※【組成・性状】

1. 組成

成分		1アンプル（1mL）中の含有量
有効成分	日局クロルフェニラミンマレイン酸塩	10mg
添加物	等張化剤を含有する。	

2. 性状

剤形	注射剤
色	無色澄明
pH	4.5～7.0
浸透圧比（生理食塩液に対する比）	約1

【効能・効果】

じん麻疹、枯草熱、皮膚疾患に伴う瘙痒（湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、薬疹、咬刺症）、アレルギー性鼻炎、血管運動性鼻炎

※【用法・用量】

クロルフェニラミンマレイン酸塩として、通常、成人1回5～10mgを1日1～2回、皮下、筋肉内または静脈内注射する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 眼内圧亢進のある患者〔抗コリン作用により眼内圧が上昇し、症状が増悪するおそれがある。〕
- (2) 甲状腺機能亢進症のある患者〔抗コリン作用により症状が増悪するおそれがある。〕
- (3) 狭窄性消化性潰瘍、幽門十二指腸通過障害のある患者〔抗コリン作用により平滑筋の運動抑制、緊張低下が起こり、症状が増悪するおそれがある。〕
- (4) 循環器系疾患のある患者〔抗コリン作用による心血管系への作用により、症状が増悪するおそれがある。〕
- (5) 高血圧症のある患者〔抗コリン作用により血管拡張が抑制され、血圧が上昇するおそれがある。〕

2. 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は従事させないよう十分注意すること。

※3. 相互作用

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
中枢神経抑制剤、アルコール、MAO阻害剤、抗コリン作用を有する薬剤	相互に作用を増強することがあるので、併用する場合には減量するなど慎重に投与すること。	中枢神経抑制剤、アルコール：本剤の中枢抑制作用により、作用が増強される。MAO阻害剤：本剤の解毒機構に干渉し、作用を遷延化し増強することがある。
ドロキシドパ、ノルアドレナリン	併用により血圧の異常上昇を来すおそれがある。	本剤はヒスタミンによる毛細血管拡張を抑制する。

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していないため、発現頻度については文献、自発報告等を参考に集計した。（再審査対象外）

(1) 重大な副作用

- (1) ショック（頻度不明）：ショックを起こすことがあるので、観察を十分に行い、チアノーゼ、呼吸困難、胸内苦悶、血圧低下等の症状があらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (2) 痙攣、錯乱（頻度不明）：痙攣、錯乱があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常があらわれた場合には、減量又は休薬等適切な処置を行うこと。
- (3) 再生不良性貧血、無顆粒球症¹⁾、²⁾（頻度不明）：再生不良性貧血、無顆粒球症があらわれることがあるので、血液検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止すること。

(2) その他の副作用

	5%以上又は頻度不明	0.1%未満
過敏症 ^{注1)}	発疹、光線過敏症等	
精神神経系	鎮静、神経過敏、頭痛、焦燥感、複視、眠気、不眠、めまい、耳鳴、前庭障害、多幸症、情緒不安、ヒステリー、振戦、神経炎、協調異常、感覚異常、霧視等	
消化器	口渇、胸やけ、食欲不振、悪心・嘔吐、腹痛、便秘、下痢等	
泌尿器	頻尿、排尿困難、尿閉等	
循環器 ^{注2)}	低血圧、心悸亢進、頻脈、期外収縮、微弱脈	
呼吸器	鼻及び気道の乾燥、気管分泌液の粘性化、喘鳴、鼻閉等	
血液 ¹⁾	溶血性貧血	血小板減少
肝臓	肝機能障害（AST（GOT）・ALT（GPT）・Al-Pの上昇等）	
その他	悪寒、発汗異常、疲労感、胸痛、月経異常	顔面蒼白

注1) 症状があらわれた場合には投与を中止すること。

注2) 症状があらわれた場合には減量又は休薬等適切な処置を行うこと。

5. 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ため、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

6. 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まわ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。]

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児には投与しないこと。[中枢神経系興奮等の抗コリン作用に対する感受性が高く、痙攣等の重篤な反応があらわれるおそれがある。]

8. 適用上の注意

- (1) **取扱い方法**：アンプルカット時に異物の混入を避けるため、アンプルの首部の周りをエタノール綿等で清拭しカットすること。
- (2) **調製方法**：ヘパリンナトリウム（カルシウム）、ダルテパリンナトリウムは、本剤と試験管内で混合すると反応し沈澱を生じることがあるので、混注は避けることが望ましい。
- (3) **筋肉内注射時**：筋肉内注射にあたっては、組織・神経等への影響を避けるため、以下の点に注意すること。
 - 1) 同一部位への反復注射はなるべく行わないこと。また、小児には特に注意すること。
 - 2) 神経走行部位を避けるよう注意すること。なお、注射針を刺入したとき、神経にあたってと思われるような激痛を訴えた場合は、直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。
 - 3) 注射器の内筒を軽くひき、血液の逆流がないことを確かめて注射すること。
 - 4) 硬結を来すことがあるので、注射直後は、局所を十分にもむこと。
- (4) **投与部位**：注射部位に一過性の刺激、灼熱感があらわれることがある。

※【薬物動態】

1. 血漿中濃度³⁾

健康成人（外国人）にクロルフェニラミンマレイン酸塩 5mg を静脈内投与したときの血漿中未変化体濃度は、投与直後に最高値を示した後、2相性に減少した。消失相の半減期は約22時間、AUCは480ng・hr/mLであった。

2. 尿・糞中排泄⁴⁾

健康成人（外国人）に³H標識クロルフェニラミンマレイン酸塩の4mgを静脈内投与したときの投与後48時間までの尿及び糞中放射能排泄率は、それぞれ投与量の36%及び0.2%であった。

3. 代謝^{3, 4, 5)}

健康成人（外国人）におけるクロルフェニラミンマレイン酸塩の主要な代謝産物としてmonodesmethyl chlorpheniramine, didesmethyl chlorpheniramineが確認されており、その他に極性の高い代謝産物が認められている。

4. 血漿蛋白結合⁴⁾

ヒト血漿蛋白結合率は、0.28 µg/mL及び1.24 µg/mLの濃度でそれぞれ72%及び69%であった（in vitro）。

【薬効薬理】

1. in vitroにおける抗ヒスタミン作用⁶⁾

本剤は、モルモット摘出回腸のヒスタミン収縮に対して拮抗作用を示し、そのIC₅₀値は1.7 µg/Lであった。

2. in vivoにおける抗ヒスタミン作用⁷⁾

本剤は、モルモットのヒスタミン誘発致死に対して防御作用を示し、そのED₅₀値は皮下投与時0.031mg/kg、静脈内投与時0.026mg/kg、腹腔内投与時0.06mg/kgであった。

※【有効成分に関する理化学的知見】

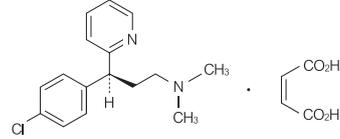
一般名：クロルフェニラミンマレイン酸塩（JAN）

Chlorpheniramine Maleate（JAN）

Chlorpheniramine（INN）

化学名：(3RS)-3-(4-Chlorophenyl)-N,N-dimethyl-3-pyridin-2-ylpropylamine monomaleate

構造式：



分子式：C₁₆H₁₉ClN₂・C₄H₄O₄

分子量：390.86

性状：本品は白色の微細な結晶である。本品は酢酸（100）に極めて溶けやすく、水又はメタノールに溶けやすく、エタノール（99.5）にやや溶けやすい。本品は希塩酸に溶ける。本品の水溶液（1→20）は旋光性を示さない。

融点：130～135℃

【包装】

クロール・トリメトン®注10mg（1 mL）：10アンプル
50アンプル

【主要文献】

- 1) Deringer, P. M. et al. : Lancet, I, 432 (1976)
- 2) Kanoh, T. et al. : Lancet, I, 546 (1977)
- 3) Huang, S. M. et al. : Eur. J. Clin. Pharmacol., 22, 359 (1982)
- 4) Peets, E. A. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 180 (2), 464 (1972)
- 5) Kasuya, F. et al. : Xenobiotica, 21 (1), 97 (1991)
- 6) Roth, F. E. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 124 (4), 347 (1958)
- 7) Speerlein, M. T. et al. (社内資料)

※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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。
MSD株式会社 MSDカスタマーサポートセンター
東京都千代田区九段北1-13-12
医療関係者の方：フリーダイヤル0120-024-961

※※製造販売元

MSD株式会社

東京都千代田区九段北1-13-12