

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散

日本薬局方 クロルフェニラミンマレイン酸塩錠

※ ヒスタール 散 1%

※ ヒスタール 錠 4mg

HISTAL

貯 法：室温保存

使用期限：外箱に表示

※		ヒスタール散 1%	ヒスタール錠 4mg
※	承認番号	22000AMX01991000	22000AMX01992000
※	薬価収載	2008 年12月	2008 年12月
	販売開始	1970 年 8 月	1970 年 8 月
	再評価結果	1975 年12月	1975 年12月

【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性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、症状が増悪するおそれがある。〕

(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、症状が増悪するおそれがある。〕

(4) 低出生体重児・新生児〔中枢神経系興奮など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。〕

【組成・性状】

販売名	ヒスタール散 1%	ヒスタール錠 4mg
有効成分	日本薬局方 クロルフェニラミンマレイン酸塩	
含 量	1g 中 10mg	1 錠中 4mg
添加物	乳糖水和物	乳糖水和物、セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸 Mg
色・剤形	白色の散剤	白色の素錠
性 状	においはなく、味は苦い	
外 形		表面 裏面 側面  直径：7.0mm 厚さ：3.1mm 重さ：120mg

【効能・効果】

じん麻疹、血管運動性浮腫、枯草熱

皮膚疾患に伴う痒疹（湿疹・皮膚炎、皮膚痒痒症、薬疹）、アレルギー性鼻炎、血管運動性鼻炎、感冒等上気道炎に伴うくしゃみ・鼻汁・咳嗽

【用法・用量】

dl-クロルフェニラミンマレイン酸塩として、通常成人 1 回 2 ～ 6mg（ヒスタール散 1%として 0.2 ～ 0.6g、ヒスタール錠 4mg として 0.5 ～ 1.5 錠）を 1 日 2 ～ 4 回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 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、緊張低下がおこり、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	本剤の中枢抑制作用により、作用が増強される
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。

- (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

種類／頻度	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、光線過敏症等
精神神経系	鎮静、神經過敏、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
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 ^{注1)}	溶血性貧血、血小板減少
肝 臓	肝機能障害〔AST (GOT)・ALT (GPT)・ALP の上昇等〕
その他	悪寒、発汗異常、疲労感、胸痛、月経異常

注 1) このような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

(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) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には、授乳を中止させること。〔授乳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

「禁忌」の項参照

8. 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。〕

【薬物動態】³⁾

1. 吸収

ヒト(健康外国人)に³H クロルフェニラミンマレイン酸塩 12mg を経口投与した場合、血中に速やかにあらわれ、投与 2 時間後に最高血中濃度に達し、その値はクロルフェニラミン 17.05ng/mL に相当し、半減期は 12 ～ 15 時間であった。

2. 排泄

ヒト(健康外国人)に³H クロルフェニラミンマレイン酸塩 12mg を経口投与した場合、投与 48 時間後の尿中回収率は投与量の 34% であり、糞便中への排泄は 1% 以下であった。糞便中への排泄が極めて少なく、腸・肝循環のパターンを示した。

【薬効薬理】

ヒスタミン、ヒスタミン様物質に対し、拮抗作用を有する。⁴⁻⁷⁾

1. ヒスタミンによる血管拡張作用や毛細血管透過性の亢進等を抑制する。
2. 皮膚発赤、痒痒感を抑制する。

【有効成分に関する理化学的知見】

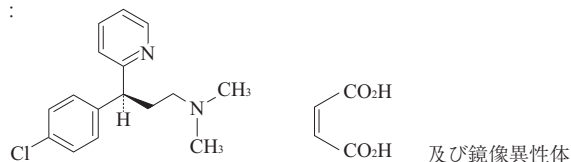
一般名：クロルフェニラミンマレイン酸塩 (Chlorpheniramine Maleate)

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

分子式：C₁₆H₁₉ClN₂・C₄H₄O₄

分子量：390.86

構造式：



性状：白色の微細な結晶である。

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。

希塩酸に溶ける。

水溶液(1 → 20)は旋光性を示さない。

【包装】

ヒスタール散 1% ：バラ 100g、1kg

ヒスタール錠 4mg：PTP 100錠(10錠×10)
1000錠(10錠×100)

【主要文献】

- 1) Deringer, P. M., et al. : Lancet, i, 432(1976)
- 2) Kanoh, T., et al. : Lancet, i, 546(1977)
- 3) Peets, E. A., et al. : J. Pharmacol, Exper. Therap., 180(2), 464(1972)
- 4) Roth, F. E., et al. : J. Pharmacol, Exper. Therap., 124(4), 347(1958)
- 5) グッドマン・ギルマン：薬理書〔上〕薬物治療の基礎と臨床 廣川書店 第4版(翻訳)(1976)
- 6) Tislow, R. et al. : Federation Proc., 8, 338(1949)
- 7) Labelle, A. et al. : J. Pharm. Exp. Therap., 113, 72(1955)

※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

ザイダスファーマ株式会社 医薬情報部

〒102-0093 東京都千代田区平河町 1-4-3

フリーダイヤル：0120-864-233

FAX：03-3264-1561

<受付時間> 9:00～17:30 (土日祝日・当社休日を除く)

※※

Zydus
dedicated to life

製造販売元

ザイダスファーマ株式会社

東京都千代田区平河町 1-4-3