

貯法：室温保存
 使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること
 * 規制区分：（散）劇薬

	錠 4 mg	散 1 %
承認番号	21700AMY00069000	21400AMZ00680000
薬価収載	2005年6月	2003年7月
販売開始	2008年4月	2008年4月
再評価結果	1996年6月	1996年6月

抗アレルギー剤

ペリアクチン錠 4 mg
 ペリアクチン散 1 %

PERIACTIN

シプロヘプタジン塩酸塩水和物錠・散

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 緑内障のある患者 [抗コリン作用により眼内圧が亢進し、症状を悪化させるおそれがある。]
2. 狭窄性胃潰瘍のある患者 [抗コリン作用により胃内容の停滞が起こり、その結果胃酸分泌亢進が起き、症状を悪化させるおそれがある。]
3. 幽門十二指腸閉塞のある患者 [抗コリン作用により胃内容の停滞、幽門十二指腸部の膨満が起こり、症状を悪化させるおそれがある。]
4. 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尿閉を悪化させるおそれがある。]
5. 気管支喘息の急性発作時の患者 [抗コリン作用により、喀痰の粘稠化・去痰困難を起こすことがあり、喘息を悪化させるおそれがある。]
6. 新生児・低出生体重児（「小児等への投与」の項参照）
7. 老齢の衰弱した患者（「高齢者への投与」の項参照）
8. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【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) 気管支喘息又はその既往歴のある患者 [抗コリン作用により、喀痰の粘稠化・去痰困難を起こすことがあり、喘息の悪化又は再発を起こすおそれがある。]
 - (2) 眼内圧亢進のある患者
 - (3) 甲状腺機能亢進症のある患者
 - (4) 心血管障害のある患者
 - (5) 高血圧症のある患者
 [(2)～(5)抗コリン作用により症状を悪化させるおそれがある。]
 (6) 乳・幼児（「小児等への投与」の項参照）
2. 重要な基本的注意
 眠気を催すことがあるので、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）

【組成・性状】

1. 組成

ペリアクチン錠 4 mg

1錠中シプロヘプタジン塩酸塩水和物 4 mg（無水物として）を含有する。

添加物としてリン酸水素カルシウム、乳糖、アルファー化デンプン、トウモロコシデンプン、ステアリン酸マグネシウムを含有する。

ペリアクチン散 1 %

1 g中シプロヘプタジン塩酸塩水和物10 mg（無水物として）を含有する。

添加物として乳糖を含有する。

2. 製剤の性状

ペリアクチン錠 4 mg

片面に割線を有する白色の素錠である。

販売名	形状			本体コード	包装コード
	重量(mg)	直径(mm)	厚さ(mm)		
ペリアクチン錠 4 mg		210	8.1	2.8	n 050

ペリアクチン散 1 %

白色の粉末で、においはない。

【効能・効果】

皮膚疾患に伴う痒痒（湿疹・皮膚炎、皮膚痒痒症、薬疹）、じん麻疹、血管運動性浮腫、枯草熱、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】

シプロヘプタジン塩酸塩として、通常成人1回4 mgを1日1～3回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アルコール	相互に作用を増強することがある。	両薬剤とも中枢神経抑制作用を有するため、併用により鎮静作用が増強される。
中枢神経抑制剤 睡眠剤 鎮静剤 トランクライザー 抗不安剤等	相互に作用を増強することがある。	両薬剤とも中枢神経抑制作用を有するため、併用により鎮静作用が増強される。
モノアミン酸化酵素阻害剤	抗コリン作用が持続、増強されるおそれがある。	機序不明
抗コリン作働薬	抗コリン作用が増強されるおそれがある。	本剤は弱いながらも抗コリン作用を有するため、併用により抗コリン作用が増強する。
セロトニン系を介して効果を発揮する抗うつ薬 選択的セロトニン再取り込み阻害剤等	これらの薬剤の作用を減弱することがある。	本剤は抗セロトニン作用を有するため、これらの薬剤によるセロトニン神経伝達増強作用が減弱する可能性がある。

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国内文献を参考に集計した。（再審査対象外）

総症例1,529例中、282例（18.44%）に副作用が認められた。その主なものは、眠気234件（15.30%）、倦怠感25件（1.64%）、口渇12件（0.78%）、頻尿12件（0.78%）であった。

(1) 重大な副作用（頻度不明）

次のような副作用があらわれることがあるので、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。

- 1) 錯乱, 幻覚
- 2) 痙攣
- 3) 無顆粒球症

重篤な血液障害があらわれることがあるので, 定期的に検査を実施するなど観察を十分に行うこと。

(2) その他の副作用

次のような症状又は異常があらわれた場合には, 投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	5%以上#又は頻度不明	0.1~5%未満
過敏症	発疹	
精神神経系	眠気#, 注意力低下, いら いら感, 興奮, 運動失調, 意識レベルの低下	めまい, もうろう感, 倦怠感, 頭痛, 不眠, しびれ感
消化器		口渇, 悪心, 食欲 不振, 下痢, 腹痛
血液	白血球減少, 血小板減少, 紫斑	
その他	食欲亢進, 粘膜乾燥, 浮腫, 肝機能異常 (AST (GOT) 上 昇, ALT (GPT) 上昇, Al-P 上昇, LDH 上昇等), 鼻出 血	頻尿

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, 減量するなど慎重に投与すること。なお, 安全性が確立されていないので高齢の衰弱した患者には投与しないこと。

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。[動物実験 (ラット) において催奇形作用が報告されている。]

(参考)

ラットに10~50mg/kg/日を妊娠7~15日の間に単回腹腔内投与あるいは2mg/kg/日を妊娠全期間にわたり連続腹腔内投与した試験及び15~50mg/kg/日を妊娠6~15日に連続経口投与した試験において, 胎児及び産児の死亡率の上昇及び形態異常を認めたとの報告がある。^{1), 2)}

- (2) 本剤投与中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

- (1) 新生児・低出生体重児に対する安全性は確立されていないので投与しないこと。[新生児へ投与し, 無呼吸, チアノーゼ, 呼吸困難を起こしたとの報告がある。]
- (2) 乳・幼児において, 過量投与により副作用が強くあらわれるおそれがあるので, 年齢及び体重を十分考慮し, 用量を調節するなど慎重に投与すること。[抗ヒスタミン剤の過量投与により, 特に乳・幼児において, 幻覚, 中枢神経抑制, 痙攣, 呼吸停止, 心停止を起こし, 死に至ることがある。]

8. 臨床検査結果に及ぼす影響

薬物スクリーニング検査 (尿, 血清等) で, 三環系抗うつ剤に対する偽陽性を示すことがある。

9. 過量投与

中枢神経症状, アトロピン様症状, 消化器症状があらわれるおそれがある。特に乳・幼児では中枢神経症状があらわれるおそれがあるので注意すること。なお処置として中枢興奮剤は使用しないこと。〔小児等への投与〕の項参照)

10. 適用上の注意 (錠)

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】

外国人のデータでは, 健康成人2名に¹⁴C-シプロヘプタジン塩酸塩5mgを経口投与したとき, 血漿中濃度は9時間後に最高に達し, その濃度はシプロヘプタジン換算量としてそれぞれ50ng/mL及び36ng/mLであった。また, 投与後6日間までの排泄量はそれぞれ尿中に投与量の67%及び77%, 糞中に33%及び23%であった。尿中排泄された代謝物の58~65%がグルクロン酸抱合体, 9~11%が硫酸抱合体, 5~6%が未抱合体であった。³⁾

(注) 本剤の承認された成人1回用量は4mgである。

【臨床成績】

国内で実施されたペリアクチン錠4mg, 散1%, シロップ0.04%による臨床試験の概要は次のとおりである。^{4)~9)}

1. 痒疹性皮膚疾患

一般臨床試験において, じん麻疹に対して85.3% (383/449例), 湿疹, 皮膚炎, 皮膚痒疹症, 薬疹等に伴う痒疹に対しては69.1% (600/868例) の有効率を示した。

2. アレルギー性疾患

一般臨床試験において, アレルギー性鼻炎に対して57.8% (26/45例), 感冒に伴うくしゃみ・鼻汁・咳嗽に対しては59.0% (59/100例), 血管運動性浮腫に対しては100% (3/3例) の有効率を示した。

【薬効薬理】

1. 抗セロトニン作用

シプロヘプタジン塩酸塩はセロトニンによるイヌの血圧上昇, ラット摘出子宮の攣縮及びラット後肢の浮腫を抑制し, その抗セロトニン活性はLSD (lysergic acid diethylamide) やhydroxindasolに匹敵ないしはそれを上回る。¹⁰⁾

2. 抗ヒスタミン作用

シプロヘプタジン塩酸塩はヒスタミンによるモルモットの気管支収縮, イヌの血圧下降及びモルモット, マウスの能動的, 受動的アナフィラキシーショックを抑制し, その抗ヒスタミン活性はクロルフェニラミンに匹敵ないしはそれを上回る。^{10), 11)}

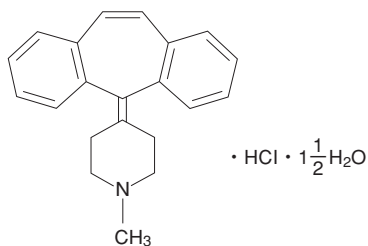
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名: シプロヘプタジン塩酸塩水和物

(Cyproheptadine Hydrochloride Hydrate)

化学名: 4-(5H-Dibenzo [a, d] cyclohepten-5-ylidene)-

1-methylpiperidine monohydrochloride sesquihydrate



分子式: C₂₁H₂₁N · HCl · 1 1/2 H₂O

分子量: 350.88

性状: 白色~微黄色の結晶性の粉末で, においはなく, 味はわずかに苦い。

メタノール又は酢酸(100)に溶けやすく, クロロホルムにやや溶けやすく, エタノール(95)にやや溶けにくく, 水に溶けにくく, ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【包装】

**ペリアクチン錠4mg

100錠 (10錠×10; PTP)

500錠 (10錠×50; PTP)

ペリアクチン散1%

500g (バラ)

【主要文献】

- 1) De La Fuente, M.et al.: Arch.Int.Pharmacodyn., 257: 168, 1982
- 2) Rodriguez González, M.D.et al.: Teratogenesis, Carcinogenesis, and Mutagenesis, 3: 439, 1983
- 3) Hintze, K.L.et al.: Drug Metab.Dispos., 3 (1): 1, 1975
- 4) 藤浪得二 他: 皮膚, 3 (2): 131, 1961
- 5) 矢村卓三 他: 臨床皮膚泌尿器科, 16 (1): 73, 1962
- 6) 小林 浩 他: 臨床皮膚泌尿器科, 16 (5): 443, 1962
- 7) 田中 宏 他: 臨床皮膚泌尿器科, 16 (6): 505, 1962
- 8) 鷹嘴研一 他: 新薬と臨床, 13 (6): 664, 1964
- 9) 曾田豊二 他: 耳鼻と臨床, 10 (1): 66, 1964
- 10) Stone, C.A.et al.: J.Pharmacol.Exp.Ther., 131 (1): 73, 1961
- 11) Ganley, O.H.: Arch.Int.Pharmacodyn., 138: 125, 1962

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎ (0120)517-215

Fax (076)442-8948