

※※印：2022年5月改訂(第13版、承継に伴う改訂)
※印：2019年8月改訂

日本標準商品分類番号
874419

貯法：しゃ光・室温・密栓保存 使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。
--

承認番号	22900AMX00634000
※※ 薬価収載	2022年5月
販売開始	1981年9月
再評価結果	1996年6月

抗アレルギー剤

※※ シプロヘプタジン 塩酸塩シロップ0.04%「NIG」

Cyproheptadine Hydrochloride Syrup

シプロヘプタジン塩酸塩シロップ

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- ※ (1) 閉塞隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある〕
- (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) 高齢の衰弱した患者(「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

【組成・性状】

組成	1mL中：シプロヘプタジン塩酸塩水和物(無水物として)……………0.4mg (添加物) エタノール、クエン酸水和物、クエン酸ナトリウム水和物、精製白糖、パラオキシ安息香酸ブチル、パラオキシ安息香酸プロピル、パラオキシ安息香酸メチル、プロピレングリコール、ポビドン、黄色4号(タートラジン)、香料
性状	特異なおいがあり、甘味を有する黄色澄明のシロップ剤
pH	3.5~4.5

【効能・効果】

皮膚疾患に伴うそう痒(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、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無水物として、通常成人1回4mg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。

【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) 開放隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある〕
- (3) 眼内圧亢進のある患者〔抗コリン作用により症状を悪化させるおそれがある〕
- (4) 甲状腺機能亢進症のある患者〔抗コリン作用により症状を悪化させるおそれがある〕
- (5) 心血管障害のある患者〔抗コリン作用により症状を悪化させるおそれがある〕
- (6) 高血圧症のある患者〔抗コリン作用により症状を悪化させるおそれがある〕
- (7) 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)

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、トランキライザー、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
抗コリン作動薬	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される。
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。

(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。

	頻度不明
過敏症	発疹
精神神経系	眠気、めまい、もうろう感、倦怠感、頭痛、不眠、しびれ感、注意力低下、いらいら感、興奮、運動失調、意識レベルの低下
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	頻尿、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

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]
- (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。

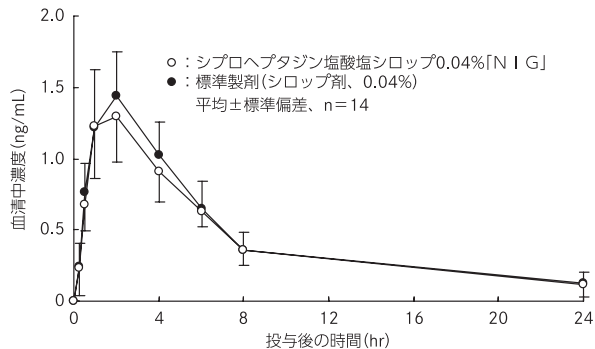
9. 過量投与

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ので、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)

【薬物動態】¹⁾

生物学的同等性試験

シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%[N I G]と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ10mL(シプロヘプタジン塩酸塩無水物として4mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=14)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%[N I G]	4	10.4±2.0	1.5±0.3	1.4±0.5	8.2±4.4
標準製剤(シロップ剤, 0.04%)	4	11.1±2.2	1.6±0.3	1.6±0.5	8.3±4.2

血清中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【薬効薬理】²⁾

セロトニン5-HT_{2A}受容体遮断薬であるが、ヒスタミンH₁受容体遮断作用も有し、臨床的には後者が利用される。すなわち、H₁受容体を介するヒスタミンによるアレルギー性反応(毛細血管の拡張と透過性亢進、気管支平滑筋の収縮、知覚神経終末刺激によるそう痒など)を抑制する。

【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-

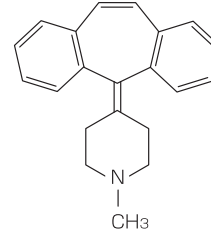
methylpiperidine monohydrochloride sesquihydrate

分子式: C₂₁H₂₁N·HCl·1½H₂O

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、味は僅かに苦い。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。

構造式:



·HCl·1½H₂O

【取扱い上の注意】³⁾

安定性試験結果の概要

加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%[N I G]は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

【包装】

シプロヘプタジン塩酸塩シロップ0.04%[N I G]
500mL

【主要文献】

- 1) 日医工岐阜工場(株)社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 第十七改正日本薬局方解説書
- 3) 日医工岐阜工場(株)社内資料(安定性試験)

※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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
TEL (0120) 517-215
FAX (076) 442-8948

販売

武田薬品工業株式会社

大阪市中央区道修町四丁目1番1号

※※  発売元
日医工株式会社
富山市総曲輪1丁目6番21

※※  製造販売元
日医工岐阜工場株式会社
富山市総曲輪1丁目6番21