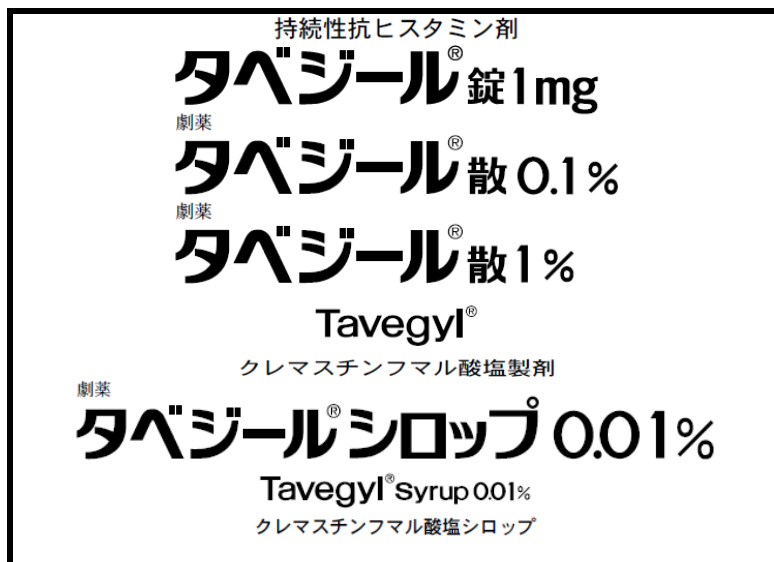


# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領（1998年9月）に準拠して作成



剤形	タベジール錠1mg：錠剤 タベジール散0.1%、タベジール散1%：散剤 タベジールシロップ0.01%：シロップ剤																																				
規格・含量	クレマスチンフマル酸塩（日局）として以下の量を含有 タベジール錠1mg：1錠中1.34mg(クレマスチンとして1mg)を含有 タベジール散0.1%：1g中1.34mg(クレマスチンとして1mg)を含有 タベジール散1%：1g中13.4mg(クレマスチンとして10mg)を含有 タベジールシロップ0.01%：1mL中0.134mg(クレマスチンとして0.1mg)を含有																																				
一般名	和名：クレマスチンフマル酸塩（日局） 洋名：Clemastine Fumarate																																				
製造・輸入承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	<table border="0"> <tr> <td>タベジール錠1mg</td> <td>承認年月日</td> <td>: 2008年6月9日（販売名変更による）</td> </tr> <tr> <td></td> <td>薬価基準収載日</td> <td>: 2008年12月19日（販売名変更による）</td> </tr> <tr> <td></td> <td>発売年月日</td> <td>: 1970年5月12日</td> </tr> <tr> <td>タベジール散0.1%</td> <td>承認年月日</td> <td>: 2008年6月9日（販売名変更による）</td> </tr> <tr> <td></td> <td>薬価基準収載日</td> <td>: 2008年12月19日（販売名変更による）</td> </tr> <tr> <td></td> <td>発売年月日</td> <td>: 1971年12月13日</td> </tr> <tr> <td>タベジール散1%</td> <td>承認年月日</td> <td>: 2008年6月9日（販売名変更による）</td> </tr> <tr> <td></td> <td>薬価基準収載日</td> <td>: 2008年12月19日（販売名変更による）</td> </tr> <tr> <td></td> <td>発売年月日</td> <td>: 1974年3月15日</td> </tr> <tr> <td>タベジールシロップ0.01%</td> <td>承認年月日</td> <td>: 2007年7月24日（販売名変更による）</td> </tr> <tr> <td></td> <td>薬価基準収載日</td> <td>: 2007年12月21日（販売名変更による）</td> </tr> <tr> <td></td> <td>発売年月日</td> <td>: 1975年2月15日</td> </tr> </table>	タベジール錠1mg	承認年月日	: 2008年6月9日（販売名変更による）		薬価基準収載日	: 2008年12月19日（販売名変更による）		発売年月日	: 1970年5月12日	タベジール散0.1%	承認年月日	: 2008年6月9日（販売名変更による）		薬価基準収載日	: 2008年12月19日（販売名変更による）		発売年月日	: 1971年12月13日	タベジール散1%	承認年月日	: 2008年6月9日（販売名変更による）		薬価基準収載日	: 2008年12月19日（販売名変更による）		発売年月日	: 1974年3月15日	タベジールシロップ0.01%	承認年月日	: 2007年7月24日（販売名変更による）		薬価基準収載日	: 2007年12月21日（販売名変更による）		発売年月日	: 1975年2月15日
タベジール錠1mg	承認年月日	: 2008年6月9日（販売名変更による）																																			
	薬価基準収載日	: 2008年12月19日（販売名変更による）																																			
	発売年月日	: 1970年5月12日																																			
タベジール散0.1%	承認年月日	: 2008年6月9日（販売名変更による）																																			
	薬価基準収載日	: 2008年12月19日（販売名変更による）																																			
	発売年月日	: 1971年12月13日																																			
タベジール散1%	承認年月日	: 2008年6月9日（販売名変更による）																																			
	薬価基準収載日	: 2008年12月19日（販売名変更による）																																			
	発売年月日	: 1974年3月15日																																			
タベジールシロップ0.01%	承認年月日	: 2007年7月24日（販売名変更による）																																			
	薬価基準収載日	: 2007年12月21日（販売名変更による）																																			
	発売年月日	: 1975年2月15日																																			
開発・製造・輸入・発売・ 提携・販売会社名	製造販売元：日新製薬株式会社																																				
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号																																					

®：登録商標

本IFは2019年7月改訂（錠、散、シロップ）の添付文書の記載に基づき改訂した。

# I F 利用の手引きの概要－日本病院薬剤師会－

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MRと略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和63年日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、I Fと略す）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第3小委員会によって新たな位置付けとI F記載要領が策定された。

## 2. I Fとは

I Fは「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な医薬品の適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はI Fの記載事項とはならない。

## 3. I Fの様式・作成・発行

規格はA4判、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。I Fは日病薬が策定した「I F記載要領」に従って記載するが、本I F記載要領は、平成11年1月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「I F記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合にはI Fが改訂・発行される。

## 4. I Fの利用にあたって

I F策定の原点を踏まえ、MRへのインタビュー、自己調査のデータを加えてI Fの内容を充実させ、I Fの利用性を高めておく必要がある。

MRへのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段にI F作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

# 目次

I. 概要に関する項目	1	V-2 用法及び用量	8
I-1 開発の経緯	1	V-3 臨床成績	8
I-2 製品の特徴及び有用性	1	(1) 臨床効果	8
II. 名称に関する項目	2	(2) 臨床薬理試験：忍容性試験	9
II-1 販売名	2	(3) 探索的試験：用量反応探索試験	9
(1) 和名	2	(4) 検証的試験	9
(2) 洋名	2	1) 無作為化平行用量反応試験	9
(3) 名称の由来	2	2) 比較試験（二重盲検等）	9
II-2 一般名	2	3) 安全性試験	9
(1) 和名（命名法）	2	4) 患者・病態別試験	9
(2) 洋名（命名法）	2	(5) 治療的使用	9
II-3 構造式又は示性式	2	1) 使用成績調査・特定使用成績調査・製造	9
II-4 分子式及び分子量	2	販売後臨床試験	9
II-5 化学名（命名法）	2	2) 承認条件として実施予定の内容又は実施	9
II-6 慣用名、別名、略号、記号番号	2	した試験の概要	9
II-7 CAS登録番号	2	VI. 薬効薬理に関する項目	10
III. 有効成分に関する項目	3	VI-1 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10
III-1 有効成分の規制区分	3	VI-2 薬理作用	10
III-2 物理化学的性質	3	(1) 作用部位・作用機序	10
(1) 外観・性状	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	10
(2) 溶解性	3	VII. 薬物動態に関する項目	11
(3) 吸湿性	3	VII-1 血中濃度の推移・測定法	11
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点	3	(1) 治療上有効な血中濃度	11
(5) 酸塩基解離定数	3	(2) 最高血中濃度到達時間	11
(6) 分配係数	3	(3) 通常用量での血中濃度	11
(7) その他の主な示性値	3	(4) 中毒症状を発現する血中濃度	11
III-3 有効成分の各種条件下における安定性	3	VII-2 薬物速度論的パラメータ	11
III-4 有効成分の確認試験法	3	(1) 吸収速度定数	11
III-5 有効成分の定量法	3	(2) バイオアベイラビリティ	11
IV. 製剤に関する項目	4	(3) 消失速度定数	11
IV-1 剤形	4	(4) クリアランス	11
(1) 剤形の区別及び性状	4	(5) 分布容積	11
(2) 製剤の物性	4	(6) 血漿蛋白結合率	11
(3) 識別コード	4	VII-3 吸収	11
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等	4	(1) 吸収部位	11
(5) 酸価、ヨウ素価等	4	(2) 吸収率	12
IV-2 製剤の組成	4	(3) 腸管循環	12
(1) 有効成分（活性成分）の含量	4	VII-4 分布	12
(2) 添加物	4	(1) 血液－脳関門通過性	12
IV-3 製剤の各種条件下における安定性	5	(2) 胎児への移行性	12
IV-4 他剤との配合変化（物理化学的变化）	7	(3) 乳汁中への移行性	12
IV-5 混入する可能性のある夾雑物	7	(4) 髄液への移行性	12
IV-6 溶出試験	7	(5) その他の組織への移行性	13
IV-7 生物学的試験法	7	VII-5 代謝	13
IV-8 製剤中の有効成分の確認試験法	7	(1) 代謝部位及び代謝経路	13
IV-9 製剤中の有効成分の定量法	7	(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種	13
IV-10 力価	7	(3) 初回通過効果の有無及びその割合	13
IV-11 容器の材質	7	(4) 代謝物の活性の有無及び比率	13
IV-12 その他	7	(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	13
V. 治療に関する項目	8	VII-6 排泄	13
V-1 効能又は効果	8	(1) 排泄部位	13
V-2 用法及び用量	8	(2) 排泄率	14
V-3 臨床成績	8	(3) 排泄速度	14
(1) 臨床効果	8	VII-7 透析等による除去率	14
(2) 臨床薬理試験：忍容性試験	9		
(3) 探索的試験：用量反応探索試験	9		
(4) 検証的試験	9		
1) 無作為化平行用量反応試験	9		
2) 比較試験（二重盲検等）	9		
3) 安全性試験	9		
4) 患者・病態別試験	9		
(5) 治療的使用	9		
1) 使用成績調査・特定使用成績調査・製造	9		
販売後臨床試験	9		
2) 承認条件として実施予定の内容又は実施	9		
した試験の概要	9		
VI. 薬効薬理に関する項目	10		
VI-1 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10		
VI-2 薬理作用	10		
(1) 作用部位・作用機序	10		
(2) 薬効を裏付ける試験成績	10		
VII. 薬物動態に関する項目	11		
VII-1 血中濃度の推移・測定法	11		
(1) 治療上有効な血中濃度	11		
(2) 最高血中濃度到達時間	11		
(3) 通常用量での血中濃度	11		
(4) 中毒症状を発現する血中濃度	11		
VII-2 薬物速度論的パラメータ	11		
(1) 吸収速度定数	11		
(2) バイオアベイラビリティ	11		
(3) 消失速度定数	11		
(4) クリアランス	11		
(5) 分布容積	11		
(6) 血漿蛋白結合率	11		
VII-3 吸収	11		
(1) 吸収部位	11		
(2) 吸収率	12		
(3) 腸管循環	12		
VII-4 分布	12		
(1) 血液－脳関門通過性	12		
(2) 胎児への移行性	12		
(3) 乳汁中への移行性	12		
(4) 髄液への移行性	12		
(5) その他の組織への移行性	13		
VII-5 代謝	13		
(1) 代謝部位及び代謝経路	13		
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種	13		
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	13		
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	13		
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	13		
VII-6 排泄	13		
(1) 排泄部位	13		
(2) 排泄率	14		
(3) 排泄速度	14		
VII-7 透析等による除去率	14		

(1) 腹膜透析	14	(2) 反復投与毒性試験	19
(2) 血液透析	14	(3) 生殖発生毒性試験	19
(3) 直接血液灌流	14	(4) その他の特殊毒性	19
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	15	<b>X. 取扱い上の注意等に関する項目</b>	20
VIII-1 警告内容とその理由	15	X-1 有効期間又は使用期限	20
VIII-2 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	15	(1) 有効期間	20
VIII-3 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	15	(2) 使用期限	20
VIII-4 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	15	X-2 貯法・保存条件	20
VIII-5 慎重投与内容とその理由	15	X-3 薬剤取扱い上の注意点	20
VIII-6 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15	X-4 承認条件	20
VIII-7 相互作用	15	X-5 包装	20
(1) 併用禁忌とその理由	15	X-6 同一成分・同効薬	20
(2) 併用注意とその理由	16	X-7 国際誕生年月日	20
VIII-8 副作用	16	X-8 製造・輸入承認年月日及び承認番号	20
(1) 副作用の概要	16	X-9 薬価基準収載年月日	20
1) 重大な副作用と初期症状	16	X-10 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	21
2) その他の副作用	17	X-11 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常（副作用として）一覧	17	X-12 再審査期間	21
(3) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度	17	X-13 長期投与の可否	21
(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	17	X-14 厚生労働省薬価基準収載の医薬品コード	21
VIII-9 高齢者への投与	17	X-15 保健給付上の注意	21
VIII-10 妊婦・産婦・授乳婦等への投与	17	<b>XI. 文献</b>	22
VIII-11 小児等への投与	17	XI-1 引用文献	22
VIII-12 臨床検査結果に及ぼす影響	17	XI-2 参考文献	22
VIII-13 過量投与	18	<b>XII. 参考資料</b>	23
VIII-14 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	18	XII-1 主な外国での発売状況	23
VIII-15 その他の注意	18	XII-2 外国での臨床文献	23
VIII-16 その他	18	<b>XIII 備考</b>	23
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	19	XIII-1 その他の関連資料	23
IX-1 一般薬理作用	19	<b>別紙</b>	24
IX-2 毒性	19		
(1) 単回投与毒性試験	19		

# I. 概要に関する項目

## I-1. 開発の経緯

タベジールは、サンドファーマ社（現ノバルティス ファーマ社、スイス）で開発された抗ヒスタミン剤である。化学的には、Benzhydryl ether群に属し、抗ヒスタミン剤の化学的分類による5つの主要グループ（エチレンジアミン、ジメチルアミノエチルエーテル、プロピルアミン、ピペラジン及びフェノチアジン系誘導体）に属する薬剤とは異なり、その特徴は、芳香族分子に特有の基礎部分の配列を有していることにある。すなわち  $\alpha$ -(p-chlordiphenyl)-ethanol と pyrrolidine の二成分がエーテル結合することによって構成されている。

国内では、錠剤が1970年5月に発売され、次いで散剤（0.1%）が1971年12月、1%散が1974年3月、そしてシロップが1975年2月に発売された。

2007年7月にタベジールシロップ0.01%として、2008年6月にそれぞれタベジール錠1mg、タベジール散0.1%、タベジール散1%として販売名称変更を行った。

2018年1月にグラクソ・スミスクライン・コンシューマー・ヘルスケア・ジャパン(株)から日新製薬(株)に製造販売承認が承継された。

## I-2. 製品の特徴及び有用性

・本剤はベンツヒドリルエーテル系に属するクレマスチンフマル酸塩の製剤で、抗ヒスタミン作用を有し、アレルギー症状に対し有効である。

・タベジール錠1mg、タベジール散0.1%、タベジール散1%の総例2,076例中何らかの副作用が報告されたのは279例（13.4%）であった。そのうち主なものは眠気191件（9.2%）、けん怠感36件（1.7%）、口渇感15件（0.7%）、食欲不振7件（0.3%）、悪心・嘔吐7件（0.3%）等であった（承認時まで及び市販後調査1975年1月までの集計）。

また、タベジールシロップ0.01%の総例3,144例中何らかの副作用が報告されたのは89例（2.8%）であった。その主なものは、眠気51件（1.6%）、食欲不振13件（0.4%）、嘔吐10件（0.3%）等であった（新開発医薬品の副作用のまとめ（その28））。

重大な副作用（頻度不明）として痙攣、興奮、肝機能障害、黄疸が報告されている。

## II. 名称に関する項目

### II-1. 販売名

(1) 和名  
タベジール<sup>®</sup>錠1mg、  
タベジール<sup>®</sup>散0.1%、タベジール<sup>®</sup>散1%  
タベジール<sup>®</sup>シロップ0.01%

(2) 洋名  
Tavegyl<sup>®</sup>  
Tavegyl<sup>®</sup>Syrup0.01%

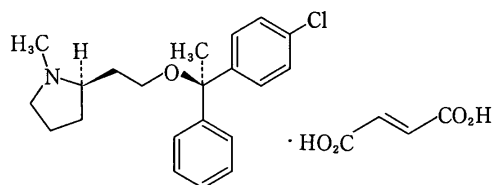
(3) 名称の由来  
特になし

### II-2. 一般名

(1) 和名 (命名法)  
クレマスチンフマル酸塩 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)  
Clemastine Fumarate (JAN)

### II-3. 構造式又は示性式



II-4. 分子式及び分子量  
 $C_{21}H_{26}ClNO \cdot C_4H_4O_4$  : 459.96

II-5. 化学名 (命名法)  
(2*R*)-2-{2-[(1*R*)-1-(4-Chlorophenyl)-1-phenylethoxy]ethyl}-1-methylpyrrolidine monofumarate

II-6. 慣用名、別名、略号、  
記号番号  
記号番号 : HS-592

II-7. CAS登録番号  
CAS-15686-51-8 (Clemastine)  
CAS-14976-57-9 (Clemastine Fumarate)

### Ⅲ. 有効成分に関する項目


Ⅲ-1. 有効成分の規制区分	劇薬（散0.1%、散1%、シロップ0.01%）、規制区分なし（錠1mg）
Ⅲ-2. 物理化学的性質	
(1) 外観・性状	白色の結晶性の粉末で、においはない。
(2) 溶解性	メタノール又は酢酸（100）にやや溶けにくく、エタノール（95）に溶けにくく、ジエチルエーテルに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。
(3) 吸湿性	該当資料なし
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	176～180℃(分解)
(5) 酸塩基解離定数	該当資料なし
(6) 分配係数	該当資料なし
(7) その他の主な示性値	旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ : +16～+18°（乾燥後、0.1g、メタノール、10mL、100mm）
Ⅲ-3. 有効成分の各種条件下における安定性	温度、湿度及び光に対して安定である。
Ⅲ-4. 有効成分の確認試験法	日本薬局方「クレマスチンフマル酸塩」の確認試験法に準ずる。 (1) 硫酸による呈色反応 (2) 芳香族第一アミン定性反応 (3) 4-ジメチルアミノベンズアルデヒド呈色反応 (4) 炎色反応試験 (5) 薄層クロマトグラフ法
Ⅲ-5. 有効成分の定量法	日本薬局方「クレマスチンフマル酸塩」の純度試験法に準ずる。 (1) 溶状：メタノールによる呈色反応 (2) 重金属：日局一般試験法、重金属試験法第2法 (3) ヒ素：日局一般試験法、ヒ素試験法第3法 (4) 類縁物質：薄層クロマトグラフ法

## IV. 製剤に関する項目

### IV-1. 剤形

#### (1) 剤形の区別及び性状

経口

	外観・性状	白色の片面割線入りの素錠
タベジール錠 1mg	外形	
	大きさ (約)	直径：7.0mm 厚さ：2.3mm 重量：0.12g
タベジール散 0.1%	性状	ほとんど白色の微細な粒を含む粉末。わずかに甘味を有する。
タベジール散 1%	性状	白色の微細な粒を含む粉末。わずかに苦味を有する。
タベジールシロップ 0.01%	性状	無色のやや粘稠な液体で、芳香と甘味及び苦味がある。

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

タベジール錠 1mg：NS 405  
タベジール散 0.1%、タベジール散 1%およびタベジールシロップ 0.01%  
には識別コードはない。

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

タベジールシロップ 0.01%：pH 約 6.4  
タベジールシロップ 0.01%：比重 約 1.12

#### (5) 酸価、ヨウ素価等

該当しない

### IV-2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

タベジール錠1mg：1錠中クレマスチンフマル酸塩（日局）1.34mg（クレマスチンとして1mg）を含有する。

タベジール散0.1%：1g中クレマスチンフマル酸塩（日局）1.34mg（クレマスチンとして1mg）を含有する。

タベジール散1%：1g中クレマスチンフマル酸塩（日局）13.4mg（クレマスチンとして10mg）を含有する。

タベジールシロップ0.01%：1mL中クレマスチンフマル酸塩（日局）0.134mg（クレマスチンとして0.1mg）を含有する。

#### (2) 添加物

タベジール錠 1mg：添加物としてトウモロコシデンプン、ポビドン、タルク、ステアリン酸マグネシウム、乳糖水和物を含有する。

タベジール散 0.1%、タベジール散 1%：添加物としてヒドロキシプロピルセルロース、無水ケイ酸、乳糖水和物を含有する。

タベジールシロップ 0.01%：エタノール、プロピレングリコール、リン酸水素ナトリウム、リン酸二水素カリウム、D-ソルビトール、サッカリンナトリウム、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、香料、トコフェロール、バニリンを含有する。



IV-3. 製剤の各種条件下における安定性

(1) タベジール錠1mgの安定性試験結果

	保存条件	保存期間	保存形態	観察項目	結果
長期保存試験	室温	36 ヶ月	PTP+アルミオーパ <sup>®</sup> -ラップ	外観、崩壊試験、溶出試験、含量、類縁物質	変化を認めず安定であった
			無色透明ガラス瓶(密栓)	外観、崩壊試験、溶出試験、含量、類縁物質	変化を認めず安定であった
加速試験	40℃・75%RH	6 ヶ月	PTP+アルミオーパ <sup>®</sup> -ラップ	外観、崩壊試験、溶出試験、含量、類縁物質、色差	変化を認めず安定であった
			無色透明ガラス瓶(密栓)	外観、崩壊試験、溶出試験、含量、類縁物質、色差	変化を認めず安定であった

無包装における安定性

	保存条件	保存期間	保存形態	観察項目	結果
高温	40℃ 遮光	3 ヶ月	ガラス瓶	外観、色差、崩壊試験、溶出試験、含量、硬度	硬度の低下を認めしたが、その他の変化は認めなかった
加湿	25℃・75%RH 遮光	3 ヶ月	シャーレ(開放)	外観、色差、崩壊試験、溶出試験、含量、硬度	硬度の低下を認めしたが、その他の変化は認めなかった
光照射	25℃・75%RH 1000Lux	120 万 Lux・hr	気密容器	外観、色差、崩壊試験、溶出試験、含量、硬度	変化を認めず安定であった

(2) タベジール散0.1%、散1%の安定性

タベジール散 0.1%

1) 室温経時試験

保存条件		試験項目	結果
ポリエチレン袋+缶	室温 6 ヶ月	性状(外観・味)、含量、薄層クロマトグラフ法、呈色反応	開始時と比較して変化を認めなかった

2) 加湿加湿経時試験

保存条件		試験項目	結果
ポリエチレン袋+缶	40℃・75%RH 6 ヶ月	性状(外観・味)、含量、薄層クロマトグラフ法、呈色反応	開始時と比較して変化を認めなかった

タベジール散 1%の安定性

1) 室温経時試験

保存条件		試験項目	結果
ポリエチレン袋+缶	室温 6 ヶ月	性状(外観・味)、含量、薄層クロマトグラフ法、呈色反応	開始時と比較して変化を認めなかった

2) 加湿加湿経時試験

保存条件		試験項目	結果
ポリエチレン袋+缶	40℃・75%RH 6 ヶ月	性状(外観・味)、含量、薄層クロマトグラフ法、呈色反応	開始時と比較して変化を認めなかった

(3) タベジールシロップ 0.01%の安定性

1) 室温経時試験

容器：褐色瓶、合成樹脂キャップ

経時条件		試験項目					
温度	期間	外観	におい	味	pH	比重	定量値
開始時		無色のやや粘稠な液体	芳香	甘味および苦味	6.3	1.12	(クレマスチンフマル酸塩) 100(%)
室温 2ロット 平均	3ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	101
	6ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	99
	9ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	100
	12ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	99
	18ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	101
	24ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	99
3ロット 平均	25ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	99
	30ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	99
	36ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	99

※ (-) 対照として同様に操作したクレマスチンフマル酸塩と比較してほとんど変化がない。

2) 苛酷経時試験

容器：褐色瓶、密栓

フェードメーター：東洋理化 FA-1 (本照射 1 時間は日光照射 48 時間に相当する)

経時条件			試験項目					
温度	光	期間	外観	におい	味	pH	比重	定量値
開始時			無色のやや粘稠な液体	芳香	甘味および苦味	6.3	1.12	(クレマスチンフマル酸塩) 100(%)
40℃	/	1ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	100
		2ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	101
		3ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	101
		4ヵ月	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	100
/	フェードメーター	1時間	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	99
		3時間	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	99
		5時間	(-)	(-)	(-)	6.3	1.12	100

※ (-) 対照として同様に操作したクレマスチンフマル酸塩と比較してほとんど変化がない。

3) 薄層クロマトグラフ法試験

薄層クロマトグラフ法の条件		第1法	第2法
薄層板		シリカゲルG	シリカゲルG
展開溶媒		エタノール・ベンゼン・強アンモニア水液 (35:15:1)	クロロホルム・メタノール混液 (4:1)
検出法		ドラーゲンドルフ試薬・強過酸化水素水	ドラーゲンドルフ試薬・強過酸化水素水
経時条件		試験結果	試験結果
	期間		
室温 (3ロット平均)	3ヵ月	(-)	(-)
	6ヵ月	(-)	(-)
	9ヵ月	(-)	(-)
	12ヵ月	(-)	(-)
	18ヵ月	(-)	(-)
	24ヵ月	(-)	(-)
40℃ (3ロット平均)	1ヵ月	(-)	(-)
	2ヵ月	(-)	(-)
	3ヵ月	(-)	(-)
	4ヵ月	(-)	(-)
フェードメーター 照射 (3ロット平均)	1時間	(-)	(-)
	3時間	(-)	(-)
	5時間	(-)	(-)

※ (-) 対照として同様に操作したクレマスチンフマル酸塩と比較してほとんど変化がない。

IV-4.	他剤との配合変化（物理化学的变化）	別紙参照：配合変化試験結果一覧表／タベジール散、タベジールシロップ参照
IV-5.	混入する可能性のある夾雑物	特になし
IV-6.	溶出試験	日局一般試験溶出試験法（パドル法） 液量：900mL 試験液：水 回転数：50回転/分
IV-7.	生物学的試験法	該当資料なし
IV-8.	製剤中の有効成分の確認試験法	1) 4-ジメチルアミノベンズアルデヒド呈色反応 2) 薄層クロマトグラフ法
IV-9.	製剤中の有効成分の定量法	液体クロマトグラフ法 操作条件 検出器：紫外吸光光度計（測定波長 220nm） カラム：液体クロマトグラフ用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てん。 移動相：メタノール・リン酸塩緩衝液混液（17：3） 定 量：試料溶液及び標準溶液のピーク面積を求め算出する。
IV-10.	カ価	該当しない
IV-11.	容器の材質	タベジール錠1mg      PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔 タベジール散0.1%    缶：ブリキ タベジール散1%      瓶：透明ガラス タベジールシロップ0.01% 瓶：褐色ガラス
IV-12.	その他	

## V. 治療に関する項目

### V-1. 効能又は効果

1. アレルギー性皮膚疾患（蕁麻疹、湿疹、皮膚炎、そう痒症）
2. アレルギー性鼻炎
3. 感冒等上気道炎に伴うくしゃみ・鼻汁・咳嗽（タベジールシロップ0.01%のみ）

### V-2. 用法及び用量

タベジール錠1mg、タベジール散0.1%、タベジール散1%：  
通常成人1日量クレマスチンとして2mgを朝晩2回に分けて経口投与する。  
なお、年齢・症状により適宜増減する。

製剤別の通常成人1日量は次のとおりである。

錠1mg	: 1日2錠	} 朝晩2回に分けて経口投与
散0.1%	: 1日2g	
散1%	: 1日0.2g	

タベジールシロップ0.01%：

通常1日20mL（クレマスチンとして2mg）を2回に分けて経口投与する。  
用量は患者の症状、年齢、体重などにより適宜増減することができる。  
幼児に対する標準的な用量として、下記の1日量がすすめられる。

年 齢	1日用量
1歳以上 3歳未満	4mL
3歳以上 5歳未満	5mL
5歳以上 8歳未満	7mL
8歳以上 11歳未満	10mL
11歳以上 15歳未満	13mL

1歳未満の乳児に使用する場合には、体重、症状などを考慮して適宜投与量を決める。

### V-3. 臨床成績

#### (1) 臨床効果

- (1) タベジール錠1mg、タベジール散0.1%、タベジール散1%  
一般臨床試験、二重盲検比較試験により、アレルギー性皮膚疾患、アレルギー性鼻炎に対する効果の検討が行われた。

疾 患 名	有 効 率
アレルギー性皮膚疾患（蕁麻疹、湿疹等を含む） <sup>1, 2)</sup>	78.2% (241/308)
アレルギー性鼻炎 <sup>3, 4)</sup>	70.3% (327/465)

投与量は、クレマスチンとして1日2mgが大部分であり、また、プラセボを対照とした二重盲検比較試験の結果、タベジールの有用性が確認された。

- (2) タベジールシロップ0.01%<sup>5~8)</sup>

一般臨床試験、二重盲検比較試験によりアレルギー性皮膚疾患（蕁麻疹、湿疹等を含む）、アレルギー性鼻炎、感冒等上気道炎に伴うくしゃみ・鼻汁・咳嗽に対する効果の検討が行われた。

疾 患 名	有 効 率
アレルギー性皮膚疾患	90.4% (169/187)
アレルギー性鼻炎、感冒等上気道炎に伴うくしゃみ・鼻汁・咳嗽	86.6% (142/164)

投与量は、1日4~20mLが大部分であった。また、タベジール錠1mgとの二重盲検比較試験の結果、タベジールシロップ0.01%とタベジール錠1mgの効果が同等であることが認められた。

(2) 臨床薬理試験 ： 忍容性試験	該当資料なし
(3) 探索的試験 ： 用量反応探索試験	該当資料なし
(4) 検証的試験	該当資料なし
1) 無作為化平行用量反応 試験	該当資料なし
2) 比較試験（二重盲検 等）	該当資料なし
3) 安全性試験	該当資料なし
4) 患者・病態別試験	該当資料なし
(5) 治療の使用	該当資料なし
1) 使用成績調査・特別調 査・市販後臨床試験	該当資料なし
2) 承認条件として実施予 定の内容又は実施した 試験の概要	該当資料なし

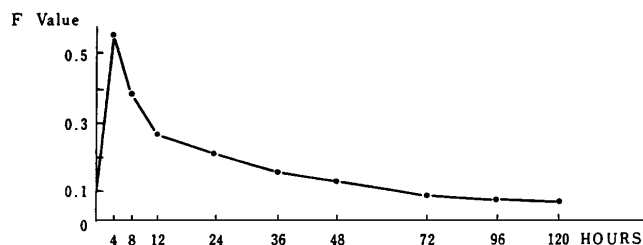
## VI. 薬効薬理に関する項目

VI-1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群	エタノールアミン系抗ヒスタミン剤（レスタミンコーワ等） プロピルアミン系抗ヒスタミン剤（ポララミン等） フェノチアジン系抗ヒスタミン剤（ピレチア、ヒベルナ等） ピペラジン系抗ヒスタミン剤（アタラックス等） ピペリジン系抗ヒスタミン剤（ペリアクチン等）
VI-2. 薬理作用	
(1) 作用部位・作用機序	本剤はクレマスチンフマル酸塩の製剤で、持続的な抗ヒスタミン作用を有し、アレルギー症状を除去あるいは軽減する。
(2) 薬効を裏付ける試験成績	(1) クレマスチンは、ヒスタミンによるモルモット回腸の収縮を抑制し ( <i>in vitro</i> )、ヒスタミンによる喘息誘発(モルモット)及び低血圧(ネコ)を抑制する。この作用は、いずれもクロルフェニラミンより強い。 <sup>9)</sup> (2) 健康成人において、ヒスタミン及びCompound 48/80の皮内投与による紅斑及び丘斑誘起に対するタベジールの抑制効果は投与後1.5時間であらわれ、11.5時間にわたり持続する。 <sup>10)</sup> (3) 抗ヒスタミン作用を示す用量では、鎮静作用(サル) <sup>9,11)</sup> 、抗コリン作用(モルモット回腸、 <i>in vitro</i> ) <sup>9)</sup> 、抗セロトニン作用(ラット子宮、 <i>in vitro</i> ) <sup>9)</sup> 及び抗アドレナリン作用(イヌ) <sup>9,11)</sup> は弱い。

## VII. 薬物動態に関する項目

### VII-1. 血中濃度の推移・測定法

〔参考：外国人のデータ〕  
 21歳の健康な成人男子6例（平均体重72.8kg）に<sup>3</sup>H(トリチウム)標識タベジール1回2mg経口投与したとき、投与後4時間でピークに達し、その後徐々に減少する。  
 (対象) 21歳の健康な成人男子6例（平均体重72.8kg）  
 (投与量) <sup>3</sup>H標識タベジール（クレマスチンとして2mg含有）を1回1錠投与



注：F Valueとは次式で示される。

$$F = \text{RSA} = \frac{\text{各 Organ 1 mg 当りの放射活性 (cpm)}}{\text{体重 1 mg 当りの放射活性 (cpm)}}$$

F = concentration Factor  
 RSA = Relative Specific Activity  
 cpm = counts per minutes

- |                   |                          |
|-------------------|--------------------------|
| (1) 治療上有効な血中濃度    | 治療上有効な血中濃度は確立していない。      |
| (2) 最高血中濃度到達時間    | 4時間（14.45ng/mL）          |
| (3) 通常用量での血中濃度    | VII-1. 「血中濃度の推移、測定法」の項参照 |
| (4) 中毒症状を発現する血中濃度 | 該当資料なし                   |

### VII-2. 薬物速度論的パラメータ

- |                 |  |
|-----------------|--|
| (1) 吸収速度定数      | 該当資料なし   |
| (2) バイオアベイラビリティ | 〔参考：外国人のデータ〕 <sup>12)</sup><br>39.2±12.4%  |
| (3) 消失速度定数      | 該当資料なし   |
| (4) クリアランス      | 〔参考：外国人のデータ〕 <sup>12)</sup><br>34.3±7.0 L/hr                                       |
| (5) 分布容積        | 〔参考：外国人のデータ〕 <sup>12)</sup><br>799±315 L<br>クレマスチンシロップ（クレマスチン2mg）を1回経口投与した試験結果による。 |
| (6) 血漿蛋白結合率     | 該当資料なし   |

### VII-3. 吸収

- |          |               |
|----------|---------------|
| (1) 吸収部位 | 消化管粘膜から吸収される。 |
|----------|---------------|

(2) 吸収率

[参考：イヌのデータ]

イヌに1.0mg/Kgの<sup>3</sup>H-タベジールを経口或いは静注し、48時間中の血液中の濃度(RSA:Relative Specific Activity)を検討した結果、いずれの場合も最初の時間で、ほぼ一定の濃度を示し、さらに経口及び静注投与後のそれぞれの濃度を比較して大差ないことは、本剤の腸管吸収の良いことを示している。<sup>9)</sup>

イヌ1.0mg/Kg <sup>3</sup>H-タベジールを経口或いは静注48時間中の血液内の濃度(RSA)

投与後の時間数	経口	静注
1	0.07	0.16
2	0.11	0.15
3	0.12	0.14
4	0.12	0.13
5	0.12	0.13
6	0.12	0.13
7	0.11	0.11
8	0.10	0.12
24	0.06	0.06
48	0.04	0.05

$$\frac{\text{生物試料の放射性活性 (dpm/mg)}}{\text{試験用量の放射性活性 (dpm)}} \times \text{体重 (mg)}$$

(3) 腸肝循環

該当資料なし

VII-4. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

(2) 胎児への移行性

該当資料なし

(3) 乳汁中への移行性

[参考：外国人のデータ]<sup>13)</sup>

症例：母親がカタルのためクレマスチン1mgを服用した12時間後に、乳児（生後10週）に眠気、興奮、授乳の拒否などが見られた。母親へのクレマスチン投与を中止後、乳児の症状は回復し、通常の授乳を行い得た。また、母乳中からクレマスチンが検出された。

(4) 髄液への移行性

該当資料なし



(5) その他の組織への移行性

[参考：ラットのデータ]

ラットの器官内におけるタバジールの分布について<sup>3</sup>H-タバジールの50mg/kgを経口投与し、8時間にわたって器官内の分布濃度(RSA)を検討した。この結果、タバジールは投与2時間後の分布で骨髄、肝、リンパ腺、脾、副腎、腎、脾、及び唾液中に高い濃度で検出されている。経口投与後2時間で、多くの器官の濃度は一定値に達し約6時間持続したが、腎においてのみ例外で、濃度は経時的に増加している。<sup>9)</sup>

ラット 50mg/kg <sup>3</sup>H-タバジール経口8時間中の器官内分布濃度(RSA)

器 官	投 与 後 の 時 間				
	30分	1時間	2時間	4時間	8時間
血 液	0.04	0.03	0.04	0.03	0.04
脳	0.02	0.03	0.03	0.03	0.03
皮 膚	0.03	0.06	0.07	0.09	0.07
心 臓	0.07	0.07	0.10	0.08	0.12
辜 丸	0.02	0.03	0.03	0.05	0.16
骨 髄	0.07	0.08	0.13	0.12	0.16
肝 臓	0.87	0.97	2.05	1.08	1.37
肺	0.21	0.30	0.46	0.31	0.33
リ ン パ 腺	0.06	0.08	0.11	0.13	0.14
脾 臓	0.09	0.12	0.16	0.13	0.15
筋 肉	0.03	0.03	0.04	0.04	0.05
副 辜 丸	0.03	0.03	0.06	0.08	0.12
副 腎	0.16	0.19	0.21	0.18	0.15
腎 臓	0.21	0.36	0.87	1.18	2.07
脾 臓	0.08	0.13	0.21	0.25	0.26
唾 液 腺	0.06	0.10	0.17	0.15	0.21
甲 状 腺	0.06	0.09	0.10	0.10	0.16

VII-5. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路
- (2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種
- (3) 初回通過効果の有無及びその割合
- (4) 代謝物の活性の有無及び比率
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

肝臓(グルクロン酸抱合体が知られている。)

該当資料なし

該当資料なし

該当資料なし

該当資料なし

VII-6. 排泄

- (1) 排泄部位

尿中及び糞中

(2) 排泄率

[参考：外国人のデータ]

投与後120時間までの尿中排泄率は44.6%、糞便中排泄率は18.9%であった。

(1) ヒトにおける<sup>3</sup>H-HS-592  
2mg錠の尿中排泄量 (%)

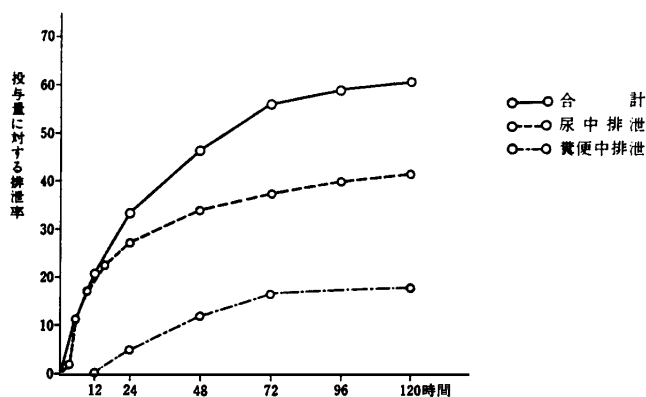
投与後の時間	尿中排泄量 (%)
0 ~ 3	3.27±1.85
3 ~ 6	8.20±1.14
6 ~ 9	6.69±1.78
9 ~ 12	3.24±1.13
12 ~ 16	3.08±0.69
16 ~ 24	4.85±1.26
24 ~ 48	7.45±1.22
48 ~ 72	4.28±0.67
72 ~ 96	2.13±0.39
96 ~ 120	1.39±0.48
0 ~ 120	44.62±4.08

(2) ヒトにおける<sup>3</sup>H-HS-592  
2mg錠の糞便中排泄量 (%)

投与後の時間	糞便中排泄量 (%)
0 ~ 12	0.04±0.05
12 ~ 24	4.91±4.67
24 ~ 48	7.25±3.89
48 ~ 72	4.85±2.70
72 ~ 96	1.24±1.33
96 ~ 120	0.61±0.42
0 ~ 120	18.92±3.52

[参考：外国人のデータ]

(3) ヒトにおける<sup>3</sup>H-タベジールの経口投与後の排泄 (2mg錠)



(3) 排泄速度

該当資料なし

VII-7. 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(3) 直接血液灌流

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

VIII-1.	警告内容とその理由	該当しない
VIII-2.	禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p><b>【禁忌（次の患者には投与しないこと）】</b></p> <ol style="list-style-type: none"> <li>1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者</li> <li>2. 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。〕</li> <li>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障害が悪化するおそれがある。〕</li> <li>4. 狭窄性消化性潰瘍又は幽門十二指腸閉塞のある患者〔抗コリン作用により消化管運動が抑制され、症状が悪化するおそれがある。〕</li> </ol> </div> <p>(解説)</p> <ol style="list-style-type: none"> <li>1. 本剤の成分に対し過敏症を起こした患者では、本剤の投与により過敏症を起こす恐れがある。</li> <li>2. 本剤は強力な抗ヒスタミン作用に比して抗コリン作用は弱いですが、抗コリン作用が現れた場合には散瞳効果により隅角が狭くなり、眼圧が上昇して症状の悪化を来す恐れがある。</li> <li>3. 本剤は強力な抗ヒスタミン作用に比して抗コリン作用は弱いですが、抗コリン作用が現れた場合には排尿困難・尿閉等がみられる恐れがある。</li> <li>4. 本剤は強力な抗ヒスタミン作用に比して抗コリン作用は弱いですが、抗コリン作用が現れた場合には消化管の運動抑制に基づく胃内容排泄の遅延をもたらす、停滞した胃内容物の刺激により胃酸分泌が増加し、症状が悪化する恐れがある。</li> </ol>
VIII-3.	効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	該当しない
VIII-4.	用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	該当しない
VIII-5.	慎重投与内容とその理由	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p><b>慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）</b></p> <ol style="list-style-type: none"> <li>(1) てんかん等の痙攣性疾患、又はこれらの既往歴のある患者〔痙攣閾値を低下させることがある。〕</li> <li>(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。〕</li> </ol> </div> <p>(解説)</p> <ol style="list-style-type: none"> <li>(1) 本剤服用中の母親から授乳した児に易刺激性、異常興奮、痙攣がみられたとの副作用報告がある。また、一般的に抗ヒスタミン剤投与により中枢刺激作用があらわれることがある。 抗ヒスタミン剤の副作用として眠気などの中枢抑制作用がよく知られているが、小児、特に乳児ではまれに不眠、興奮等の中枢刺激作用がみられることがあるとされている。また、てんかんの素因のある小児では抗ヒスタミン剤により痙攣発作が誘発されることが報告されている。一般に抗ヒスタミン剤の中毒時の痙攣等は抗コリン作用の関与が考えられているが、近年脳内ヒスタミンが抑制系の伝達に関与することが示唆されており、また、抗ヒスタミン剤が痙攣閾値を低下させることが動物実験において証明されている。</li> </ol>
VIII-6.	重要な基本的注意とその理由及び処置方法	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p>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。</p> </div> <p>(解説)</p> <p>本剤は抗ヒスタミン作用を有し、眠気の副作用が認められている。</p>
VIII-7.	相互作用	
	(1) 併用禁忌とその理由	該当しない

(2) 併用注意とその理由

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 鎮静剤 催眠剤等 アルコール	中枢神経抑制作用が増強されることがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	いずれも中枢神経抑制作用を有するため。
抗コリン剤 アトロピン等 MAO 阻害剤	抗コリン作用が増強されることがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	作用を増強させるため。

(解説)

中枢神経抑制作用を有するこれらの薬剤と併用すると相互に作用が増強され、眠気や精神運動機能低下等がより起こりやすくなるため注意する必要がある。本剤投与中の飲酒は控えること。

また、本剤は弱いながら抗コリン作用を有することから、抗コリン剤、MAO 阻害剤との併用により、抗コリン作動性による副作用の増強が考えられる。

VIII-8. 副作用

(1) 副作用の概要

タバジール錠 1mg、タバジール散 0.1%、タバジール散 1%

総例 2,076 例中、何らかの副作用が報告されたのは 279 例 (13.4%) であった。そのうち主なものは眠気 191 件 (9.2%)、けん怠感 36 件 (1.7%)、口渇感 15 件 (0.7%)、食欲不振 7 件 (0.3%)、悪心・嘔吐 7 件 (0.3%) 等であった。  
(承認時まで及び市販後調査 1975 年 1 月までの集計)

タバジールシロップ 0.01%

総例 3,144 例中何らかの副作用が報告されたのは 89 例 (2.8%) であった。その主なものは、眠気 51 件 (1.6%)、食欲不振 13 件 (0.4%)、嘔吐 10 件 (0.3%) 等であった。  
(新開発医薬品の副作用のまとめ (その 28) )

1) 重大な副作用と初期症状

- 1) 痙攣、興奮 (頻度不明) : 痙攣、興奮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 (乳児、幼児では特に注意すること)。
- 2) 肝機能障害、黄疸 (頻度不明) : AST (GOT)、ALT (GPT)、ALP、LDH、 $\gamma$ -GTP の上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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。

(解説)

1) 「VIII-5. 慎重投与」の項参照。

2) 本剤との因果関係が否定できない重篤な肝機能障害が認められた症例が報告されている。

2) その他の副作用

タベジール錠 1mg、タベジール散 0.1%、タベジール散 1%

	5%以上又は頻度不明	0.1%～5%未満	0.1%未満
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹	—	—
精神神経系	眠気、浮動性めまい	頭重、けん怠感	—
消化器	—	悪心・嘔吐、口渇、食欲不振	下痢
肝臓	AST (GOT)、ALT (GPT)、ALP、LDH、 $\gamma$ -GTP の上昇	—	—

注) このような場合には投与を中止すること。

タベジールシロップ 0.01%

	頻度不明	0.1%～5%未満	0.1%未満
過敏症 <sup>注)</sup>	—	—	発疹
精神神経系	浮動性めまい	眠気	頭重、けん怠感
消化器	口渇	悪心・嘔吐、食欲不振、下痢	—
肝臓	AST (GOT)、ALT (GPT)、ALP、LDH、 $\gamma$ -GTP の上昇	—	—

注) このような場合には投与を中止すること。

(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常(副作用として)一覧

該当資料なし

(3) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「Ⅷ-2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)」の項を参照

Ⅷ-9. 高齢者への投与

タベジール錠 1mg、タベジール散 0.1%、タベジール散 1%

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。

Ⅷ-10. 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) 授乳中の婦人には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。〔母乳中へ移行することが報告されている。〕

(解説)

- (1) 本剤は妊娠における十分な比較試験が行われておらず、安全性が確立していないため記載した。  
 (2) 本剤服用中の母親から授乳した児に易刺激性、異常興奮が見られたとの副作用報告がある(「Ⅷ-5. 慎重投与」の項参照)。

Ⅷ-11. 小児等への投与

乳児、幼児に投与する場合には、観察を十分に行い慎重に投与すること。〔痙攣、興奮等の中枢神経症状があらわれることがある。〕

(解説)

「Ⅷ-5. 慎重投与」の項参照。

Ⅷ-12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

VIII-13.	過量投与	<p>徴候、症状：中枢神経抑制、興奮、口渇、瞳孔散大、潮紅、胃腸症状等        処置：一般的な薬物除去法（催吐、胃洗浄、活性炭投与等）により、除去する。        また必要に応じて対症療法を行う。</p>
VIII-14.	適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	<p>タベジール錠1mg</p> <p>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、更には穿孔を起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）</p>
VIII-15.	その他の注意	該当しない
VIII-16.	その他	なし

## IX. 非臨床試験に関する項目

IX-1. 一般薬理

抗ヒスタミン作用に比べ、抗コリン、抗セロトニン作用及び中枢作用は弱い。<sup>9~11)</sup>

IX-2. 毒性

(1) 単回投与毒性試験

LD<sub>50</sub> 値(mg/kg)は下表のとおりである。<sup>11)</sup>

動物種 投与経路	マウス	ラット	ウサギ
経口	730	3,550	>1,000

(2) 反復投与毒性試験

ラット (20・60・200・600・1,200mg/kg 7週 経口)  
600mg/kg及び1,200mg/kg投与群に体重増加の抑制がみられた。

ラット (20・60・200・600mg/kg 26週 経口)

アカゲザル (15mg/kg 26週 経口)<sup>9)</sup>

ラット600mg/kg投与群に体重の増加の抑制がみられたほかは、特記すべき所見は認められなかった。

(3) 生殖発生毒性試験

マウス (0.3・3・30mg/kg 妊娠2日から10日まで 経口)

ラット (3・30・100mg/kg 妊娠1日から20日まで 経口)

ウサギ (0.3・3・30mg/kg 妊娠2日から14日まで 経口)

いずれの試験においても催奇形作用は認められなかった。

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 取扱い上の注意等に関する項目

X-1.	有効期間又は使用期限	使用期限：包装に表示の使用期限内に使用すること タベジール錠1mg 3年 タベジール散0.1% 3年 タベジール散1% 3年 タベジールシロップ0.01% 3年															
X-2.	貯法・保存条件	室温保存															
X-3.	薬剤取扱い上の注意点	幼小児の手の届かない所に保管すること。（タベジールシロップ0.01%のみ）															
X-4.	承認条件	なし															
X-5.	包装	タベジール錠1mg 100錠（PTP）、500錠（PTP）、1,000錠（PTP） タベジール散0.1% 500g（缶） タベジール散1% 100g（瓶） タベジールシロップ0.01% 500mL（瓶）															
X-6.	同一成分・同効薬	同一成分：各社後発品 同効薬：ジフェンヒドラミン、クロルフェニラミンマレイン酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩等															
X-7.	国際誕生年月日	該当資料なし															
X-8.	製造・輸入承認年月日及び承認番号	1)承認年月日 タベジール錠1mg 2008年6月9日（販売名変更による） タベジール散0.1% 2008年6月9日（販売名変更による） タベジール散1% 2008年6月9日（販売名変更による） タベジールシロップ0.01% 2007年7月24日（販売名変更による）  2)承認番号 タベジール錠1mg 22000AMX01633000（販売名変更による） タベジール散0.1% 22000AMX01635000（販売名変更による） タベジール散1% 22000AMX01634000（販売名変更による） タベジールシロップ0.01% 21900AMX01050000（販売名変更による）  <参考> 旧販売名															
		<table border="1"> <thead> <tr> <th>薬剤名</th> <th>承認年月日</th> <th>承認番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>タベジール（錠）</td> <td>1970年1月17日</td> <td>(45AM輸) 11</td> </tr> <tr> <td>タベジール散（0.1%）</td> <td>1971年7月15日</td> <td>(46AM) 1491</td> </tr> <tr> <td>タベジール1%散</td> <td>1973年3月1日</td> <td>(48AM) 248</td> </tr> <tr> <td>タベジールシロップ</td> <td>1974年8月19日</td> <td>(49AM輸) 66</td> </tr> </tbody> </table>	薬剤名	承認年月日	承認番号	タベジール（錠）	1970年1月17日	(45AM輸) 11	タベジール散（0.1%）	1971年7月15日	(46AM) 1491	タベジール1%散	1973年3月1日	(48AM) 248	タベジールシロップ	1974年8月19日	(49AM輸) 66
薬剤名	承認年月日	承認番号															
タベジール（錠）	1970年1月17日	(45AM輸) 11															
タベジール散（0.1%）	1971年7月15日	(46AM) 1491															
タベジール1%散	1973年3月1日	(48AM) 248															
タベジールシロップ	1974年8月19日	(49AM輸) 66															
X-9.	薬価基準収載年月日	タベジール錠1mg 2008年12月19日 タベジール散0.1% 2008年12月19日 タベジール散1% 2008年12月19日 タベジールシロップ0.01% 2007年12月21日  <参考> 旧販売名															
		<table border="1"> <thead> <tr> <th>薬剤名</th> <th>薬価基準収載年月日</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>タベジール（錠）</td> <td>1970年8月1日</td> </tr> <tr> <td>タベジール散（0.1%）</td> <td>1972年12月13日</td> </tr> <tr> <td>タベジール1%散</td> <td>1974年2月15日</td> </tr> <tr> <td>タベジールシロップ</td> <td>1975年1月1日</td> </tr> </tbody> </table>	薬剤名	薬価基準収載年月日	タベジール（錠）	1970年8月1日	タベジール散（0.1%）	1972年12月13日	タベジール1%散	1974年2月15日	タベジールシロップ	1975年1月1日					
薬剤名	薬価基準収載年月日																
タベジール（錠）	1970年8月1日																
タベジール散（0.1%）	1972年12月13日																
タベジール1%散	1974年2月15日																
タベジールシロップ	1975年1月1日																



X-10.	効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	該当しない	
X-11.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	該当しない	
X-12.	再審査期間	該当しない	
X-13.	長期投与の可否	該当しな	
X-14.	厚生労働省薬価基準収載の医薬品コード	タベジール錠1mg	4419008F1431
		タベジール散0.1%	4419008B1073
		タベジール散1%	4419008B2070
		タベジールシロップ0.01%	4419008Q1157
X-15.	保険給付上の注意	なし	

## XI. 文献

### XI-1. 引用文献

- 1) 末永義則：西日本皮膚科 31(2), 161-167, 1969
- 2) 簗野 倫：臨床薬理 3(3), 248-253, 1972
- 3) 杉浦 茂：耳鼻咽喉科 43(11), 931-942, 1971
- 4) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科 42(7), 555-557, 1970
- 5) 牧野孝三ほか：新薬と臨床 9(9), 1803-1806, 1972
- 6) 長谷川誠ほか：新薬と臨床 22(2), 323-326, 1973
- 7) 海老原勉ほか：診療と新薬 9(9), 1787-1793, 1972
- 8) 小堀辰治ほか：臨床評価 2(2), 259-269, 1974
- 9) Weidmann, H. et al. : Boll. Chim. Farm. 106(7), 467-496, 1967
- 10) Kerp, L. et al. : Med. Welt 17, 2794-2798, 1966
- 11) Römer, D. et al. : Med. Welt 17, 2791-2794, 1966
- 12) Schran, H. F. et al. : J. Clin. Pharmacol. 36, 911-922, 1996
- 13) Kolt T. H. H. G. et al. : Lancet I, 914-915, 1982

### XI-2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 参考資料

XII-1. 主な外国での発売状況 | 該当資料なし

## XIII. 備考

XIII-1. その他の関連資料 | なし

## ＜配合変化試験結果一覧表／タベジールシロップ＞

## 配合変化のみられない薬剤

鎮咳去痰剤	プロチンシロップ（第一三共）、アスベリンシロップ（田辺三菱）、濃厚プロチンコデイン配合シロップ（第一三共）、メジコン配合シロップ（塩野義）、イノリンシロップ（田辺三菱）
抗生物質製剤	エリスロシンドライシロップ（アボット）、ケフレックスシロップ用細粒（塩野義）
サルファ剤	アプシードシロップ（第一三共）
精神神経用剤 催眠鎮静剤	トリクロリールシロップ（アルフレッサ）、セルシンシロップ（武田）
総合感冒剤 解熱鎮痛剤	セキコデ配合シロップ（日医工）
ビタミン剤 総合ビタミン剤	フラビタンシロップ（アステラス）
抗てんかん剤	ザロンチンシロップ（第一三共）
副腎ホルモン剤	リンデロンシロップ（塩野義）、デカドロンエリキシル（日医工）
消化器用剤	プリンペランシロップ（アステラス）
酵素製剤	レフトーゼシロップ（日本新薬）

## 配合変化のみられた薬剤

精神神経用剤	アタラックス-Pシロップ 0.5% （ファイザー）	配合後3時間で凝集沈殿を起こす。凝集物は振っても元に戻らない。
止血剤	トランサミンシロップ（第一三共）	配合直後濁りを生じる。

注）上記配合変化試験結果は試験当時のものである。薬剤の販売名（会社名）は2014年6月時点での各社添付文書を参考とした。

## ＜配合変化試験結果一覧表／タベジール散＞

## 外観上変化が見られなかった薬剤

催眠鎮静剤	ブロムワレリル尿素、フェノバルビタール、ニトラゼパム散
解熱鎮痛剤	アセトアミノフェン、アスピリン、スルピリン、ポンタール散
精神神経用剤	クロルプロマジン10倍散、クロルジアゼポキシド10倍散、ジアゼパム散、セレナール10倍散
鎮痙剤	パパベリン塩酸塩
強心剤	カフェイン
鎮咳・去痰剤	コデインリン酸塩100倍散、エフェドリン塩酸塩散、チペピジンヒベンズ酸散、フスタゾール散、ジヒドロコデインリン酸塩100倍散、デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物散
健胃消化剤	タカジアスターゼ、SM散
制酸剤	合成ケイ酸アルミニウム、ケイ酸アルミン酸マグネシウム、(局)酸化マグネシウム
整腸剤	ラクボン末
副腎ホルモン剤	プレドニゾロン100倍散、ベタメタゾン1000倍散
ビタミン剤	リボフラビン100倍散、ニコチン酸アミド散、ビタミンB <sub>6</sub> 100倍散、リボフラビン酪酸エステル顆粒、アスコルビン酸20倍散、
カルシウム剤	乳酸カルシウム
肝臓用剤	リバオール散
酵素製剤	リゾチーム塩酸塩顆粒

## 配合により外観上変化が見られた薬剤

パンクレアチン	最悪条件(30℃・92%RH)で10日目に吸湿
炭酸水素ナトリウム	最悪条件(30℃・92%RH)で7日目に変色〈黄色〉

注）上記配合変化試験結果は試験当時のものである。