

## 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2013に準拠して作成

抗ヒスタミン剤

**ポララミン<sup>®</sup>散1%    ポララミン<sup>®</sup>錠2mg**

d-クロルフェニラミンマレイン酸塩製剤

**ポララミン<sup>®</sup>シロップ0.04%    ポララミン<sup>®</sup>ドライシロップ0.2%**

d-クロルフェニラミンマレイン酸塩シロップ                      d-クロルフェニラミンマレイン酸塩ドライシロップ

**POLARAMINE<sup>®</sup>**

剤形	散剤(粉末)・裸錠(割線入り)・シロップ剤・ドライシロップ剤(細粒)		
製剤の規制区分	該当しない		
規格・含量	散 1 % : 1g 中 日局 d-クロルフェニラミンマレイン酸塩 10mg 含有 錠 2 mg : 1錠 中 日局 d-クロルフェニラミンマレイン酸塩 2mg 含有 シロップ 0.04% : 1mL 中 日局 d-クロルフェニラミンマレイン酸塩 0.4mg 含有 ドライシロップ 0.2% : 1g 中 日局 d-クロルフェニラミンマレイン酸塩 2mg 含有		
一般名	和名: d-クロルフェニラミンマレイン酸塩(JAN) 洋名: d-Chlorpheniramine Maleate(JAN)		
製造販売承認年月日 薬価基準収載 発売年月日		ポララミン <sup>®</sup> 散 1%	ポララミン <sup>®</sup> 錠 2mg
	製造販売承認年月日	1965年8月4日	1959年7月22日
	薬価基準収載	2008年12月19日 (販売名変更による)	1976年9月1日
	発売年月日	1965年9月1日	1959年10月26日
		ポララミン <sup>®</sup> シロップ 0.04%	ポララミン <sup>®</sup> ドライシロップ 0.2%
	製造販売承認年月日	1963年9月3日	1986年10月3日
	薬価基準収載	2008年12月19日 (販売名変更による)	2008年12月19日 (販売名変更による)
	発売年月日	1964年1月4日	1987年11月12日
開発・製造販売(輸入)・提携・販売会社名	製造販売元: 高田製薬株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	高田製薬株式会社 学術部 TEL: 0120-989-813 FAX: 048-816-4183 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.takata-seiyaku.co.jp">https://www.takata-seiyaku.co.jp</a>		

本IFは2016年4月改訂(シロップ、ドライシロップ)、2015年9月改訂(散、錠)の添付文書の記載に基づき改訂した。最新の添付文書情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

## IF 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

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書(以下、添付文書と略す)がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会(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、IF と略す)の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事、医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

### 2. IF とは

IF は「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、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IF の様式]

①規格はA4版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

#### [IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」(以下、「IF 記載要領 2008」と略す)により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

### 3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。

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、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の利用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の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」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月)

# 目次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	1. 警告内容とその理由	24
1. 開発の経緯	1	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	24
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	24
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	24
1. 販売名	2	5. 慎重投与内容とその理由	25
2. 一般名	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	25
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	25
4. 分子式及び分子量	3	8. 副作用	26
5. 化学名（命名法）	3	9. 高齢者への投与	27
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	27
7. CAS登録番号	3	11. 小児等への投与	28
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	28
1. 物理化学的性質	4	13. 過量投与	28
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	14. 適用上の注意	29
3. 有効成分の確認試験法	4	15. その他の注意	29
4. 有効成分の定量法	4	16. その他	29
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>30</b>
1. 剤形	5	1. 薬理試験	30
2. 製剤の組成	6	2. 毒性試験	30
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>32</b>
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	1. 規制区分	32
5. 調製法及び溶解後の安定性	9	2. 有効期間又は使用期限	32
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	10	3. 貯法・保存条件	32
7. 溶出性	14	4. 薬剤取扱い上の注意点	32
8. 生物学的試験法	14	5. 承認条件等	32
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	14	6. 包装	33
10. 製剤中の有効成分の定量法	14	7. 容器の材質	33
11. 力価	14	8. 同一成分・同効薬	34
12. 混入する可能性のある夾雑物	15	9. 国際誕生年月日	34
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	15	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	34
14. その他	15	11. 薬価基準収載年月日	34
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>16</b>	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	34
1. 効能又は効果	16	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	34
2. 用法及び用量	16	14. 再審査期間	34
3. 臨床成績	16	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	35
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>18</b>	16. 各種コード	35
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	18	17. 保険給付上の注意	35
2. 薬理作用	18	<b>XI. 文献</b> .....	<b>36</b>
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>19</b>	1. 引用文献	36
1. 血中濃度の推移・測定法	19	2. その他の参考文献	36
2. 薬物速度論的パラメータ	20	<b>XII. 参考資料</b> .....	<b>37</b>
3. 吸収	20	1. 主な外国での発売状況	37
4. 分布	21	2. 海外における臨床支援情報	37
5. 代謝	22	<b>XIII. 備考</b> .....	<b>39</b>
6. 排泄	23	その他の関連資料	39
7. トランスポーターに関する情報	23		
8. 透析等による除去率	23		
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>24</b>		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

クロルフェニラミンマレイン酸塩は、1947年に米国 Schering 社の Sperber、Papa、Schwenk らの研究により初めて合成され、1949年に Tislow らによりその生理作用が報告された化合物である。その後の研究によりその当時、抗ヒスタミン剤中最も作用が強く副作用の少ない薬剤 1 つであることが報告された。本剤はクロルフェニラミンマレイン酸塩の *d* 型異性体であり、この *d* 体は *dl* 体のクロルフェニラミンマレイン酸塩に対し約 2 倍作用が強い。

2014年12月にポララミン散 1%、ポララミン錠 2mg 及びポララミンシロップ 0.04%は MSD 株式会社から高田製薬株式会社に承継された。また同年 12 月にポララミンドライシロップ 0.2%は MSD 株式会社から高田製薬株式会社に販売移管された。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 抗ヒスタミン剤 ( $H_1$  拮抗薬)のうち本剤に代表されるプロピルアミン系薬剤は強力な抗ヒスタミン作用を持つ薬剤で、抗ヒスタミン作用と共に抗コリン作用も有している。我が国においては、本剤は 50 年以上繁用されており、有効性と安全性が確立している。
- (2) 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は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)  
重大な副作用として、ショック(頻度不明)、痙攣、錯乱(頻度不明)、再生不良性貧血、無顆粒球症<sup>12, 13)</sup>(頻度不明)があらわれることがある。  
(「VIII. 8. (2) 重大な副作用(頻度不明)と初期症状」参照)

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

ポララミン®散1%  
ポララミン®錠2mg  
ポララミン®シロップ0.04%  
ポララミン®ドライシロップ0.2%

#### (2) 洋名

POLARAMINE® POWDER  
POLARAMINE® TABLETS  
POLARAMINE® SYRUP  
POLARAMINE® DRY SYRUP

#### (3) 名称の由来

特になし

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

*d*-クロルフェニラミンマレイン酸塩 (JAN)

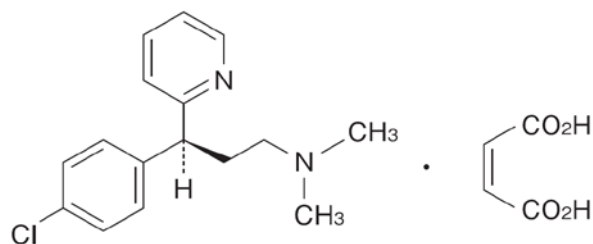
#### (2) 洋名（命名法）

*d*-Chlorpheniramine Maleate (JAN)  
Dexchlorpheniramine (INN)  
Dexchlorpheniramine Maleate (USP)

#### (3) ステム

不明

### 3. 構造式又は示性式



#### 4. 分子式及び分子量

分子式:  $C_{16}H_{19}ClN_2 \cdot C_4H_4O_4$

分子量: 390.86

#### 5. 化学名 (命名法)

(3*S*)-3-(4-Chlorophenyl)-*N,N*-dimethyl-3-pyridin-2-ylpropylamine monomaleate

#### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

#### 7. CAS 登録番号

2438-32-6

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末で、においはなく味は苦い。

##### (2) 溶解性

表Ⅲ-1 *m*-クロルフェニラミンマレイン酸塩の各種溶媒に対する溶解性

溶媒	日本薬局方による溶解性の用語
水	極めて溶けやすい
メタノール	極めて溶けやすい
酢酸(100)	極めて溶けやすい
エタノール(99.5)	溶けやすい
<i>N,N</i> -ジメチルホルムアミド	溶けやすい
クロロホルム	溶けやすい
エーテル	極めて溶けにくい

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

111～115℃

##### (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： $[\alpha]_D^{20}$ ：+39.5～+43.0°（乾燥後、0.5g、*N,N*-ジメチルホルムアミド、10mL、100mm）

吸光度： $E_{1cm}^{1\%}$ （265nm）：210～220（乾燥後、5mg、0.5N 硫酸試液、250mL）

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

光に対して不安定である。

#### 3. 有効成分の確認試験法

- (1) 第三アミンの呈色反応
- (2) 融点測定法によるマレイン酸の確認
- (3) 赤外吸収スペクトル

#### 4. 有効成分の定量法

過塩素酸による滴定法



## IV. 製剤に関する項目


### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

表IV-1 ポララミン®散 1%の組成・性状

品名	ポララミン®散 1%
性状	白色の粉末

表IV-2 ポララミン®錠 2mg の組成・性状

品名	ポララミン®錠 2mg		
性状	二分割線のある白色楕円形の裸錠		
外形	表面直径	裏面重さ	側面厚さ
	 長径 約 7.7mm 短径 約 5.1mm	 約 0.10g	 約 2.9mm
識別コード	TTS-363		

表IV-3 ポララミン®シロップ 0.04%の組成・性状

品名	ポララミン®シロップ 0.04%
性状	だいたい色のほとんど澄明の液で、特異なおいがあり、味は甘い。
pH	5.5～6.8

表IV-4 ポララミン®ドライシロップ 0.2%の組成・性状

品名	ポララミン®ドライシロップ 0.2%
性状	淡黄赤色の細粒で、芳香があり、味は甘い。

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

ポララミン®散 1%:なし

ポララミン®錠 2mg:TTS-363

ポララミン®シロップ 0.04%:なし

ポララミン®ドライシロップ 0.2%:なし

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

ポララミンシロップ 0.04%:pH 5.5~6.8

浸透圧比 9.9

粘度(動粘度) 18.3mm<sup>2</sup>/sec(設定温度 25℃)

比重 1.250~1.262

熱量 2.72kcal/mL

## 2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

表IV-5 有効成分の含量

ポララミン®散 1%	ポララミン®錠 2mg	ポララミン®シロップ 0.04%	ポララミン®ドライシロップ 0.2%
1g 中 <i>d</i> -クロルフェニラミン マレイン酸塩 10mg	1錠中 <i>d</i> -クロルフェニラミン マレイン酸塩 2 mg	1mL 中 <i>d</i> -クロルフェニラミン マレイン酸塩 0.4mg	1g 中 <i>d</i> -クロルフェニラミン マレイン酸塩 2 mg

(2) 添加物

表IV-6 添加物

ポララミン®散 1%	ポララミン®錠 2mg	ポララミン®シロップ 0.04%	ポララミン®ドライシロップ 0.2%
トウモロコシデンプン、 乳糖水和物	トウモロコシデンプン、 ステアリン酸マグネシウム、 乳糖水和物	白糖、D-ソルビトール 液、塩化ナトリウム、ク エン酸ナトリウム水和 物、エタノール、メント ール、安息香酸ナトリウ ム、香料、黄色 5 号	D-マンニトール、精製 白糖、香料、黄色 5 号

(3) その他

「IV. 製剤に関する項目 1. 剤形 (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等」の項参照

## 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

#### 4. 製剤の各種条件下における安定性

##### ■承継時データ

##### (1) ポララミン®散 1%

表IV-7 ポララミン®散 1%の安定性

試験条件			結果
保存条件	保存状態	期間	
室温、遮光	褐色瓶、密栓	4ヶ月	変化なし
室温、散光	シャーレ、開栓	4ヶ月	変化なし
室温、遮光、相対湿度 70%	シャーレ、開栓	4ヶ月	変化なし
35℃、遮光、相対湿度 80%	シャーレ、開栓	4ヶ月	2.5ヶ月以上で外観上わずかに褐色を帯びた。

##### (2) ポララミン®錠 2mg

表IV-8 ポララミン®錠 2mg の安定性

試験条件			結果
保存条件	保存状態	期間	
室温、散光	無色シャーレ、開栓	4ヶ月	変化なし
室温、遮光	褐色瓶、密栓	4ヶ月	変化なし
35℃、遮光、相対湿度 80%	無色シャーレ、開栓	4ヶ月	変化なし
室温、10,000lux～11,000lux	無色シャーレ、開栓	32時間	変化なし

##### (3) ポララミン®シロップ 0.04%

表IV-9 ポララミン®シロップ 0.04%の安定性:ポリエチレン瓶入り

試験条件		結果				
保存条件	期間	性状			pH	含量 (%)
		外観	におい	味		
初期値		だいたい色澄明	特異なにおい	甘い	6.39	107.3
室温、散光	6ヶ月	変化なし	変化なし	変化なし	6.36	105.1
40℃、遮光、 相対湿度 75%	6ヶ月	変化なし	変化なし	変化なし	6.25	104.5

\* pH、含量は3ロット測定の平均値

##### (4) ポララミン®ドライシロップ 0.2%

表IV-10 ポララミン®ドライシロップ 0.2%の安定性:ポリエチレン瓶入り

試験条件		結果		
保存条件	期間	性状	pH	残存率 (%)
初期値		淡黄赤色の細粒で芳香があり、味は甘い	5.01	100
室温、散光	6ヶ月	変化なし	5.06	98.8
40℃、遮光、 相対湿度 75%	6ヶ月	変化なし	5.09	99.6

\* pH、残存率は3ロットにつき3回測定の平均値

表IV-11 ポララミン®ドライシロップ 0.2%の安定性:1g 分包

試験条件		結果		
保存条件	期間	性状	pH	残存率 (%)
初期値		淡黄赤色の細粒で芳香があり、味は甘い	5.01	100
室温、散光	6ヶ月	変化なし	5.01	99.9
40℃、遮光、 相対湿度 75%	6ヶ月	変化なし	5.03	99.6

\*pH、残存率は3ロットにつき3回測定の平均値

■2018年社内報告

ポララミン錠 2mg は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表IV-12 ポララミン錠 2mg の無包装安定性(温度・湿度) (1ロット)

保存条件/ 保存形態	試験項目	試験開始時	1箇月	2箇月	3箇月
40℃ / 遮光 開放※1	性状	※2	※2		
	溶出性 (%)	98.7	96.8	97.1	97.1
	定量法 (%)	100.8	99.9	99.7	99.5
	硬度 (kg 重)	7.5	7.0	5.9	5.7
	硬度評価	-	◎	◎	◎
25℃ 75%RH / 遮光 開放※1	性状	※2	※2		
	溶出性 (%)	98.7	97.0	98.6	98.2
	定量法 (%)	100.8	99.7	99.7	100.0
	硬度 (kg 重)	7.5	2.1	2.1	2.1
	硬度評価	-	○	○	○

※1：試験開始時は褐色ガラス瓶。

※2：白色の片面に割線の入った円形の錠剤

表IV-13 ポララミン錠 2mg の無包装安定性(光) (1ロット)

保存条件 / 保存形態	試験項目	試験開始時	60万 lx・hr	120万 lx・hr
1000 lx / 開放※1	性状	※2	※2	
	溶出性 (%)	98.7	99.1	97.8
	定量法 (%)	100.8	100.1	99.4
	硬度 (kg 重)	7.5	7.3	6.4
	硬度評価	-	◎	◎

※1：試験開始時は褐色ガラス瓶。

※2：白色の片面に割線の入った円形の錠剤

<参考>

【硬度】

分類	評価基準	判定
変化なし	硬度変化が 30%未満の場合	◎
変化あり (規格内)	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重以上の場合	○
変化あり (規格外)	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重未満の場合	△

平成 11 年 8 月 20 日付「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について (答申)」  
(日本病院薬剤師会) 一部改変

## 5. 調製法及び溶解後の安定性

### ポララミン®ドライシロップ 0.2%

本品 100g に水を加えて溶かし、500mL としたものにつき、室温で 7 日間及び 1～5℃(冷蔵庫)で 14 日間保存した時の性状(外観・におい・味)、pH、残存率について観察・測定した。

表Ⅳ-12 ドライシロップ溶解後の安定性:室温 無色透明のガラス瓶

	初期値	1 日後	3 日後	5 日後	7 日後
性状	淡黄赤色澄明のやや粘稠な液体で芳香(オレンジ臭)があり、味は甘い	ほとんど変化なし	ほとんど変化なし	白っぽい浮遊物があり、芳香はやや消失し、腐敗臭を發した	白っぽい浮遊物があり、芳香はやや消失し、腐敗臭を發した
pH	5.07	5.10	5.05	4.62	4.26
残存率 (%)	100	99.8	99.7	99.7	99.7

\*pH、残存率は 3 ロットにつき 3 回測定の平均値

表Ⅳ-13 ドライシロップ溶解後の安定性:1～5℃(冷蔵庫)無色透明のガラス瓶

	初期値	1 日後	3 日後	7 日後	14 日後
性状	淡黄赤色澄明のやや粘稠な液体で芳香(オレンジ臭)があり、味は甘い	変化なし	変化なし	変化なし	わずかに白っぽい浮遊物があり、芳香がやや消失した
pH	5.07	5.08	5.07	5.05	5.00
残存率 (%)	100	99.4	99.8	99.5	99.9

室温保存では、5 日経過後に性状の変化、pH の低下が認められた。残存率の低下は認められなかった。冷蔵庫での保存では、14 日後に性状の変化が認められた。pH の変化、残存率の低下は認められなかった。以上のことから、水溶液調整後は室温での長時間放置は避け冷蔵し、出来るだけ速やかに使用するべきである。

## 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

### (1) ポララミン®散 1%配合変化試験

#### 配合方法

ポララミン®散 1%と各薬剤を表に示した配合比で、めのう乳鉢により混合した。

#### 保存条件

25°C・60%RH 蛍光灯下（約 600Lux）、30 日間

#### 試験項目及び方法

外観：日本薬局方 13 改正に従い観察した。

メクロルフェニラミンマレイン酸塩含量：液体クロマトグラフ法で配合剤中の含量を測定した。

分類	配合製剤	配合比 (ポララミン散 1% : 配合製剤)	試験項目	配合製剤の 性 状	25°C・60%RH 蛍光灯下	
					試験開始時	30 日後
鎮解 痛 剤 熱	アセトアミノフェン (健栄製薬)	2 : 3	外 観 含 量	白色の粉末	白色の粉末 100	変化なし 93.9
解 熱 剤	スルピリン (丸石製薬)	1 : 1	外 観 含 量	白色の粉末	白色の粉末 100	変化なし 98.1
強 心 剤	カフェイン (吉田製薬)	6 : 1	外 観 含 量	白色の粉末	白色の粉末 100	変化なし 101.5
制 酸 剤	合成ケイ酸アルミニウム (丸石製薬)	6 : 5	外 観 含 量	白色の粉末	白色の粉末 100	変化なし 99.2
消解 炎熱 鎮 剤 痛	アスピリン (健栄製薬)	2 : 3	外 観 含 量	白色の粉末	白色の粉末 100	変化なし 96.0
制 酸 剤	酸化マグネシウム (健栄製薬)	2 : 1	外 観 含 量	白色の粉末	白色の粉末 100	変化なし 94.5

### (2) ポララミン®シロップ 0.04%配合変化試験

#### 試験法

ポララミン®シロップ 0.04%と他剤の配合は、ポララミン®シロップ 0.04%2.5mL に他剤を 2.5mL 加え、さらに精製水 5.0mL を加えることを原則とした。但し、他剤が液状でない場合は他剤 2.5g を精製水 5.0mL に溶解又は懸濁の後、ポララミン®シロップ 0.04%2.5mL にこれを加え、さらに精製水 2.5mL を加えることとした。

#### 試験結果

性 状 ー：変化が認められなかったもの

▽：変化が若干認められたもの

再分散性 △：沈降するが再分散したもの

▲：沈降し再分散性が若干悪かったもの

■：沈降し再分散性が悪かったもの

分類	配合製剤	試験期間 条件	試験項目	被配合液の 性 状	性 状		再分散性
					試験開始時	試験終了時	
抗 生 物 質	オラスポア ドライシロップ	7 日 冷 所	外 観 pH	橙 色 懸 濁 pH 4.3	淡 橙 色 懸 濁 pH 4.4	— —	△
	ケフレックス シロップ用細粒	7 日 冷 所	外 観 pH	橙 色 懸 濁 pH 5.4	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.5	— —	▲
	デランテール DS 250	7 日 室 温	外 観 pH	淡 橙 色 懸 濁 pH 4.1	淡 橙 色 懸 濁 pH 4.6	— ▽	△ (1, 3日) →▲ (7日)
	セプチコール ドライシロップ	7 日 室 温	外 観 pH	淡 赤 橙 色 懸 濁 pH 5.0	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.1	— ▽	△ (1, 3日) →▲ (7日)
	アイロゾン 顆 粒	7 日 室 温	外 観 pH	橙 赤 色 懸 濁 pH 4.2	橙 赤 色 懸 濁 pH 4.2	— —	△
	ミノマイシン 顆 粒	7 日 室 温	外 観 pH	橙 色 半 澄 明 pH 4.1	橙 色 半 澄 明 pH 4.4	— —	△
	ビブラマイシン シロップ	7 日 冷 所	外 観 pH	赤 色 懸 濁 pH 6.9	淡 赤 色 懸 濁 pH 6.9	— ▽	△
	パセトシン 細 粒	7 日 室 温	外 観 pH	淡 赤 色 懸 濁 pH 5.1	淡 赤 橙 色 懸 濁 pH 5.5	— —	△
	サワリン 細 粒	7 日 室 温	外 観 pH	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.1	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.4	— —	△
	バストシリン 細 粒	7 日 冷 所	外 観 pH	橙 色 懸 濁 pH 6.0	橙 色 懸 濁 pH 6.0	— —	▲
	ケフラル 細粒小児用	7 日 室 温	外 観 pH	淡 黄 色 懸 濁 pH 4.6	淡 橙 黄 色 懸 濁 pH 5.1	— —	■
	ピクシリン ドライシロップ	4 日 室 温	外 観 pH	pH 4.4	橙 色 pH 5.0	4日目に透明度増加 ▽	
	バイシリン乳液	5 日 室 温	外 観 pH 力 価	白 色 乳 液	淡 橙 色 懸 濁 pH 6.2 —	淡 黄 色 懸 濁 液 — —	—
鎮 咳 去 痰 剤	フスタザール シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	白 色 懸 濁 pH 6.4	淡 橙 色 半 透 明 pH 6.5	— —	△
	アストミン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	橙 色 澄 明 pH 4.2	淡 橙 色 澄 明 pH 6.5	— —	
	メジコン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	淡 黄 褐 色 澄 明 pH 3.9	淡 橙 色 澄 明 pH 4.5	— —	
	イノリン シロップ	7 日 冷 所	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 4.3	淡 橙 色 澄 明 pH 4.7	— —	
	メプチン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 4.0	淡 橙 色 澄 明 pH 4.7	— —	
	ホクナリン ドライシロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 4.0	淡 橙 色 澄 明 pH 6.4	— —	
	ビスルボン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 4.0	淡 橙 色 澄 明 pH 4.2	— —	
	ザジデン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 5.2	淡 橙 色 澄 明 pH 5.6	— —	
	アスベリン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	白 色 懸 濁 pH 4.9	淡 橙 色 半 澄 明 pH 5.2	— —	△
	フスコデ シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	淡 褐 色 澄 明 pH 4.7	淡 橙 色 澄 明 pH 5.8	— —	
気 管 支 拡 張 剤	プロチン液	7 日 室 温	外 観 pH	暗 赤 褐 色 pH 7.7	暗 赤 褐 色 pH 7.4	— ▽	
	ムコソルバン シロップ	7 日 25℃	外 観	微 黄 色 澄 明	淡 橙 色 澄 明	赤 色 沈 澱*	
	ブリカニール シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 4.0	淡 橙 色 澄 明 pH 4.5	— —	
	ベネトリン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 3.8	淡 橙 色 澄 明 pH 3.9	— —	

分類	配合製剤	試験期間 条件	試験項目	被配合液の 性 状	性 状		再分散性
					試験開始時	試験終了時	
気道 粘液調整 粘膜炎 抑制剤	ムコダイン シロップ 5%	10 日 室温	外 観 pH	褐色 pH 6.6	淡橙色澄明 pH 6.5	— —	
鎮 痙 剤	バルピン液	7 日 室温	外 観 pH	無色澄明 pH 4.3	淡橙色澄明 pH 5.2	— —	
酵 素 製 剤	イノクチン ドライシロップ	7 日 室温	外 観 pH	白色懸濁 pH 3.5	淡橙色懸濁 pH 3.7	— —	△
	レフトーゼ シロップ	7 日 室温	外 観 pH	無色澄明 pH 3.6	淡橙色澄明 pH 6.1	— —	
	オペック顆粒	7 日 室温	外 観 pH	白色懸濁 pH 3.5	淡橙色懸濁 pH 4.1	— —	△
総 合 胃 腸 薬	PL 顆粒	7 日 室温	外 観 pH	白色懸濁 pH 4.8	淡橙赤色懸濁 pH 6.1	— —	△
解 熱 鎮 痛 剤	ポントール シロップ	7 日 室温	外 観 pH	白色懸濁 pH 4.4	淡橙色懸濁 pH 4.7	— —	▲
ミ ニ ミ ン タ レ ン 製 剤	ポポン S	14 日 室温	外 観 pH	pH 4.8	帯橙黄色 pH 4.8	▽ —	
抗 生 菌 薬	アタラックス P シロップ	10 日 室温	外 観 pH	pH 5.0	帯橙黄色 pH 4.8	▽ ▽	
ミ ニ ミ ン タ レ ン 製 剤	クレマニル ドライシロップ	7 日 室温	外 観 pH	白色懸濁 pH 4.1	淡橙色懸濁 pH 5.7	— —	■
用 薬	プリンペラン シロップ	7 日 室温	外 観 pH	無色澄明 pH 2.7	淡橙色澄明 pH 3.8	— —	

\* ポラミンシロップ 0.04%、ムコソルバンシロップの配合による赤色沈殿物の生成には、配合比、保存容器、保存温度、保存期間に影響を受けることが確認された。

### (3) ポラミンドライシロップ 0.2%配合変化試験

#### 試験法

他剤が液状の場合、ポラミンドライシロップ 0.2%2.5g を精製水 5.0mL に溶解したものと他剤 2.5mL とを混合し、さらに精製水 2.5mL を加えて混合した。

他剤が液状でない場合、ポラミンドライシロップ 0.2%2.5g を精製水 5.0mL に溶解したものと、他剤 2.5g を精製水 5.0mL に溶解又は懸濁したものとを混合した。

#### 試験結果

性 状 —:変化が認められなかったもの

▽:変化が若干認められたもの

再分散性 △:沈降するが再分散したもの

▲:沈降し再分散性が若干悪かったもの

■:沈降し再分散性が悪かったもの



分類	配合製剤	試験期間 条件	試験項目	被配合液の 性 状	性 状		再分散性
					試験開始時	試験終了時	
抗 生 物 質	オラスポア ドライシロップ	7 日 冷 所	外 観 pH	橙 色 懸 濁 pH 4.3	淡 橙 色 懸 濁 pH 4.4	— —	△
	ケフレックス シロップ用細粒	7 日 冷 所	外 観 pH	橙 色 懸 濁 pH 5.3	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.2	— —	▲
	デランテール DS 250	7 日 室 温	外 観 pH	淡 橙 色 懸 濁 pH 4.2	淡 橙 色 懸 濁 pH 4.3	— ▽	△
	セプチコール ドライシロップ	7 日 室 温	外 観 pH	淡 赤 橙 色 懸 濁 pH 4.9	淡 橙 色 懸 濁 pH 4.9	— ▽	△
	アイロゾン 顆 粒	7 日 室 温	外 観 pH	橙 赤 色 懸 濁 pH 4.1	橙 赤 色 懸 濁 pH 4.1	— —	△
	ミノマイシン 顆 粒	7 日 室 温	外 観 pH	橙 色 半 澄 明 pH 3.9	橙 色 半 澄 明 pH 4.0	— —	△
	ビブラマイシン シロップ	7 日 冷 所	外 観 pH	赤 色 懸 濁 pH 6.8	淡 赤 色 懸 濁 pH 6.2	— ▽	△
	パセトシン 細 粒	7 日 室 温	外 観 pH	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.0	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.0	— —	△
	サワシリン 細 粒	7 日 室 温	外 観 pH	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.0	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.0	— —	△
	バストシリン 細 粒	7 日 冷 所	外 観 pH	橙 色 懸 濁 pH 6.0	淡 橙 色 懸 濁 pH 6.0	— —	▲
	ケフラル 細粒小児用	7 日 室 温	外 観 pH	淡 黄 色 懸 濁 pH 4.5	淡 黄 橙 色 懸 濁 pH 4.6	— —	■
	ケフラル 細粒小児用	7 日 室 温	外 観 pH	淡 黄 橙 色 懸 濁 pH 4.5	淡 黄 橙 色 懸 濁 pH 4.5	— ▽	■ (2日、7日) (注1)
鎮 咳 去 痰 剤	フスタゾール シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	白 色 懸 濁 pH 6.3	淡 橙 色 半 澄 明 pH 5.6	— —	△
	アストミン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	橙 色 懸 濁 pH 4.1	淡 橙 色 澄 明 pH 4.2	— —	
	メジコン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	淡 黄 褐 色 澄 明 pH 3.8	淡 橙 色 澄 明 pH 3.9	— —	
	イノリン シロップ	7 日 冷 所	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 4.2	淡 橙 色 澄 明 pH 4.3	7 日 目 淡 黄 橙 色 澄 明 —	
	メプチン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 3.9	淡 橙 色 澄 明 pH 4.0	— —	
	ホクナリン ドライシロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 5.1	淡 橙 色 澄 明 pH 4.9	— —	
	ビスルボン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 3.5	淡 橙 色 澄 明 pH 3.6	— —	
	ザジテン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 5.1	淡 橙 色 澄 明 pH 5.1	— —	
	アスベリン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	白 色 懸 濁 pH 4.8	淡 橙 色 半 澄 明 pH 4.9	— —	△
	フスコデ シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	淡 褐 色 澄 明 pH 4.7	淡 橙 色 澄 明 pH 4.8	— —	
酵 素 製 剤	イノクチン 顆 粒	7 日 室 温	外 観 pH	白 色 懸 濁 pH 3.3	淡 橙 色 半 澄 明 pH 3.2	— —	△
	レフトーゼ シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 3.6	淡 橙 色 澄 明 pH 4.5	— —	
	オパック 顆 粒 (10%)	7 日 室 温	外 観 pH	白 色 懸 濁 pH 3.1	淡 橙 色 懸 濁 pH 3.2	— —	△

分類	配合製剤	試験期間 条件	試験項目	被配合液の 性 状	性 状		再分散性
					試験開始時	試験終了時	
感冒 合 剤	幼児用 PL 顆粒	7 日 室 温	外 観 pH	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.3	淡 橙 色 懸 濁 pH 5.0	— —	△
解熱 鎮痛 剤	ボンタール シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	白 色 懸 濁 pH 4.2	淡 橙 色 懸 濁 pH 4.5	— —	▲
抗 ヒスタ ミン 剤	クレマニル ドライシロップ	7 日 室 温	外 観 pH	白 色 懸 濁 pH 3.9	淡 橙 色 懸 濁 pH 4.3	— —	△ (1, 3日) →▲ (7日)
用 消 化 器 官 薬	プリンペラン シロップ	7 日 室 温	外 観 pH	無 色 澄 明 pH 2.4	淡 橙 色 澄 明 pH 3.0	— —	

(注 1) ポララミン®ドライシロップ 0.2%1.0g を精製水 5.0mL に溶解したものと、他剤 2.5g を精製水 5.0mL に懸濁

## 7. 溶出性

ポララミン®錠 2mg  
該当資料なし

## 8. 生物学的試験法

ポララミン®シロップ 0.04%

日本薬局方「保存効力試験法」に従い、微生物学的保存試験を実施した結果、5種の被検菌株の添加 14 日後及び 28 日後の保存効力はいずれも「適」であった。

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) ポララミン®散 1%
  - 1) 臭化シアン試液による呈色
  - 2) 融点
- (2) ポララミン®錠 2mg
  - 1) 臭化シアン試液による呈色
  - 2) 融点
- (3) ポララミン®シロップ 0.04%
 

日局「旋光度測定法」による
- (4) ポララミン®ドライシロップ 0.2%
  - 1) ドラーゲンドルフ試液による第三アミンの呈色反応
  - 2) 日局「融点測定法」による

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

ポララミン®シロップ 0.04%、ポララミン®ドライシロップ 0.2%：日局「吸光度測定法」による

## 11. 力価

該当しない

**12. 混入する可能性のある夾雑物**

該当資料なし

**13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報**

該当しない

**14. その他**

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

蕁麻疹、血管運動性浮腫、枯草熱、皮膚疾患に伴う瘙痒(湿疹・皮膚炎、皮膚瘙痒症、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

### 2. 用法及び用量

<ポララミン散 1%・ポララミン錠 2mg・ポララミンシロップ 0.04%>

メクロルフェニラミンマレイン酸塩として、通常、成人には1回2mgを1日1~4回経口投与する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

<ポララミンドライシロップ 0.2%>

メクロルフェニラミンマレイン酸塩として、通常、成人1回2mgを1日1~4回、用時溶解して経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ (2009年4月以降承認品目)

該当しない

#### (2) 臨床効果

<ポララミン散 1%・ポララミン錠 2mg>

国内及び海外での総数177例について臨床効果を検討したところ、有効率は75.7%(134/177)で疾患別では、蕁麻疹 80.5%(33/41)、皮膚疾患に伴う瘙痒(湿疹、皮膚炎、皮膚瘙痒症、薬疹)74.6%(85/114)、枯草熱、アレルギー性鼻炎 75.0%(12/16)であった。

<ポララミンシロップ 0.04%>

国内における総症例236例について、メクロルフェニラミンマレイン酸塩・シロップの有効性を検討したところ、その有効率は64.8%(153/236)であり、疾患別では蕁麻疹 81.8%(45/55)、湿疹・皮膚炎 59.7%(108/181)であった。

<ポララミンドライシロップ 0.2%>

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

<単回投与試験> <反復投与試験>

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

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

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(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

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

抗ヒスタミン剤(特にプロピルアミン系)

プロピルアミン系抗ヒスタミン剤には、クロダミン、アレルギン及びネオレスタミン(一般名: *d*-クロルフェニラミンマレイン酸塩)、ベネン(塩酸トリプロリジン)などがある。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### 【作用部位】

主として奏効器官の H<sub>1</sub> 受容体

##### 【作用機序】

主として H<sub>1</sub> 受容体と結合することにより、遊離ヒスタミンと受容体との結合を競合的かつ可逆的に阻害するとされている。

##### 【薬理学的特徴】

抗ヒスタミン剤のうちその薬効が極めて強力な薬剤の一つであり、副作用が少なく治療量と中毒量の差が大きい。又、抗ヒスタミン剤特有の中枢興奮作用又は抑制作用のうち抑制作用は比較的弱く、多くの抗ヒスタミン剤と同様に抗コリン作用(アトロピン様作用)を有している。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 【*in vitro*における抗ヒスタミン作用】<sup>1)</sup>

モルモット摘出回腸において、ヒスタミンで誘発させた筋収縮に対する本剤(*d*体)、*dl*体及び *l*体の 50%有効量(ED<sub>50</sub>)を求めた結果、ED<sub>50</sub>値はそれぞれ 0.8 μg/L、1.7 μg/L 及び 190.0 μg/L であり、*d*体の抗ヒスタミン作用は *dl*体、*l*体よりも強かった。

##### 【*in vivo*における抗ヒスタミン作用】<sup>1)</sup>

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 ED<sub>50</sub>値は 0.056mg/kg(経口)であった。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

##### <作用発現時間>

ほとんどの第一世代抗ヒスタミン剤は 15~60 分(USP DI 26th Edit. 2006)

##### <持続時間>

4~8 時間(USP DI 26th Edit. 2006)

4~25 時間の報告もある<sup>2)</sup>。

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

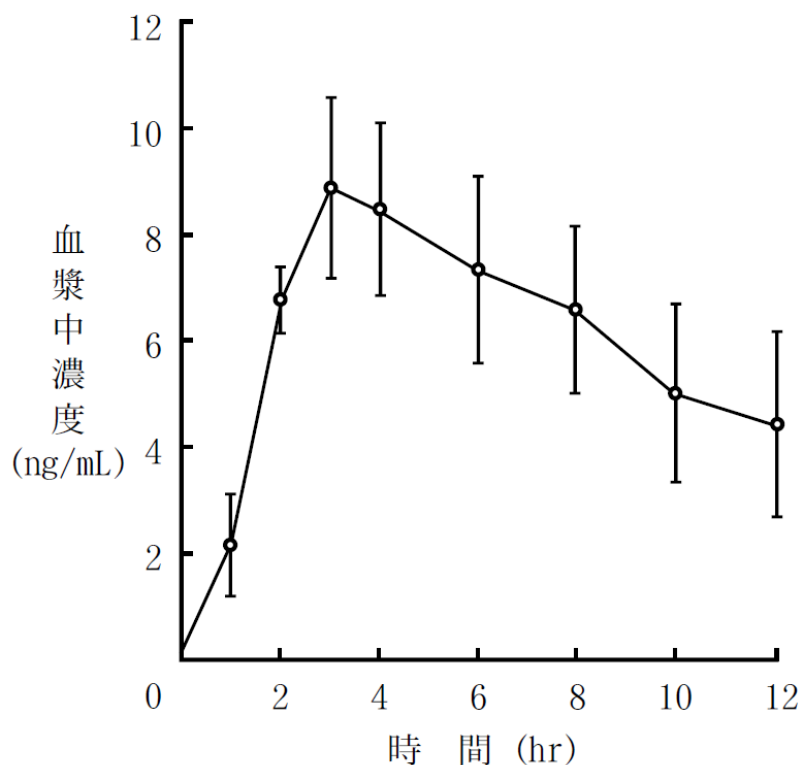
該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間

健康成人男子 4 例(日本人)に本薬 4mg をカプセルに充填して空腹状態で経口投与した時の血漿中クロルフェニラミン濃度は投与 3 時間後にピークに達した。なお、血漿中クロルフェニラミン濃度は HPLC 法で測定した<sup>3)</sup>。

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>3)</sup>

健康成人に、*o*-クロルフェニラミンマレイン酸塩 4mg を経口投与したときの血漿中濃度推移及び薬物速度論的パラメータは以下に示したとおりであった。(注:本剤の承認された 1 回用量 2mg である。)



表VII-1 *o*-クロルフェニラミンマレイン酸塩のパラメータ

例数	Cmax (ng/mL)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC (ng·hr/mL)
4	9.0 ± 1.7	7.9 ± 2.5	73.0 ± 15.9

(mean ± S. E.)

#### (4) 中毒域

該当資料なし

<参考>

中毒症状と摂取した抗ヒスタミン剤の量との間に、dose-dependent の関係はないものとされ、症状発現には個人の感受性が大きく影響し、特に小児では、感受性が強いとされている<sup>4)</sup>。

#### (5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

#### (6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) 吸収速度定数

$K_a: 0.816 \pm 0.139 \text{ h}^{-1}$

(健常成人男子 4 例に本薬 4mg をカプセルに充填して空腹時投与)<sup>3)</sup>

#### (3) バイオアベイラビリティ

F: 25~50% (クロルフェニラミン)<sup>5)</sup>

#### (4) 消失速度定数

$K_e: 0.110 \pm 0.035 \text{ h}^{-1}$

(健常成人男子 4 例に本薬 4mg をカプセルに充填して空腹時投与)<sup>3)</sup>

#### (5) クリアランス

該当資料なし

#### (6) 分布容積

$V_d: 325.4 \pm 24.7 \text{ L}$  (健常成人男子 4 例に本薬 4mg をカプセルに充填して空腹時投与)<sup>3)</sup>

#### (7) 血漿蛋白結合率

72% (クロルフェニラミン) (USP-DI 26th Edit. 2006)

### 3. 吸収

#### (1) 吸入部位

小腸と考えられている<sup>5)</sup>。

#### (2) 吸収率

クロルフェニラミンの場合、経口吸収は不完全で、バイオアベイラビリティ(F 値)は 25~50% である<sup>5)</sup>。



- (3) 腸肝循環  
クロルフェニラミンで認められている<sup>6)</sup>。

## 4. 分布

### (1) 血液—脳関門通過性

PETにより脳内H<sub>1</sub>受容体の分布を定量したとき、*d*-クロルフェニラミンマレイン酸塩2mgはほぼ50%の脳内H<sub>1</sub>受容体を占拠した<sup>7)</sup>。

(抗ヒスタミン剤の脳内への移行は脳内受容体の占拠率により客観的に評価できるとされる)

### (2) 血液—胎盤関門通過性

該当資料なし

[参考]

雌雄ラットに10、20mg/kgの*d*-クロルフェニラミンマレイン酸塩を交配前8週間経口投与した場合、両群とも薬剤によると思われる新生仔の異常は認められなかった<sup>8)</sup>。

### (3) 乳汁への移行性

該当資料なし

[参考]

動物及びヒトで本剤の乳汁移行を検討した報告はないが、フマル酸クレマスチン(タベジール)、塩酸ジフェンヒドラミン(レスタミン)などでは乳汁に移行することが報告されている。

### (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

該当資料なし

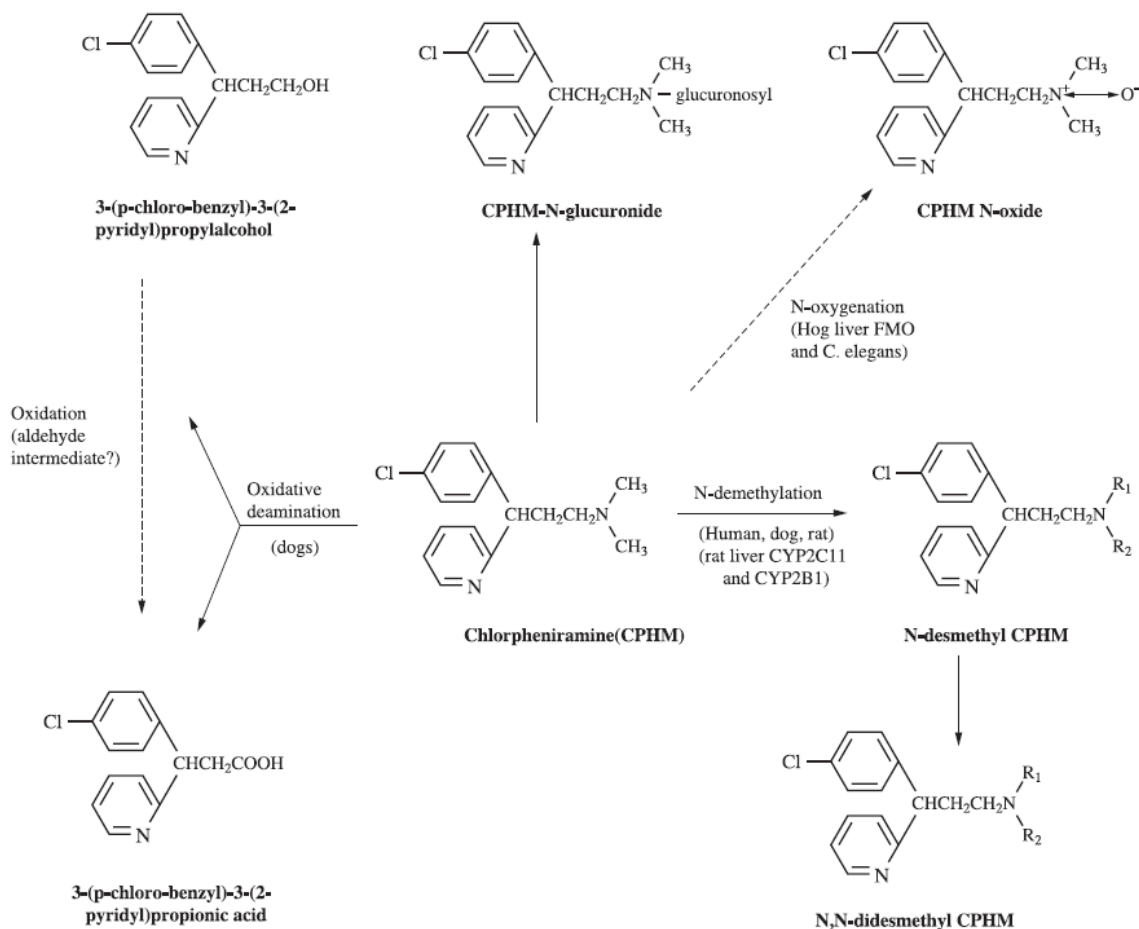
[参考]

クロルフェニラミンの場合、動物試験において主として肝・肺・腎に分布すると報告されている<sup>9)</sup>。

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

クロルフェニラミンは経口投与後その大部分が主として肝で代謝され、非極性化合物 (monodesmethyl-chlorpheniramine と didesmethyl-chlorpheniramine) と極性化合物に代謝される<sup>10)</sup>。



(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

CYP2C11、CYP2B1、CYP2D6<sup>10)</sup>

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

(2) 排泄率

ヒト（健常外国人）に<sup>3</sup>H標識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。糞便中は排泄が極めて少なく腸・肝循環のパターンを示した<sup>6)</sup>。

(3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 8. 透析等による除去率

### 腹膜透析

腹膜透析患者に経口投与した場合は、7～10 時間の半減期であった<sup>11)</sup>。

### 血液透析

血液透析患者に経口投与した場合、最終的な算出曲線から予測された半減期は、280～330 時間であった。透析により抽出される割合は無視できる範囲であった<sup>11)</sup>。

### 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

### 1. 警告内容とその理由

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【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（「11. 小児等への投与」の項参照）

（解説）

- (1)本剤の有効成分又は添加物又は類似化合物に対し過敏症の既往歴のある患者では、過敏症を発現するおそれがある。
- (2)抗ヒスタミン剤がもつ抗コリン作用により、散瞳と共に房水通路の狭窄によって眼圧が上昇し、症状を悪化させるおそれがある。
- (3)抗ヒスタミン剤がもつ抗コリン作用により、排尿筋の弛緩と括約筋の収縮が起こり、尿の貯留をきたすおそれがある。
- (4)抗ヒスタミン剤の重要な副作用として、中枢神経抑制作用とともに幻覚、興奮、運動失調、協調運動不能及び痙攣等の中枢神経興奮作用がある。急速な発育過程にある低出生体重児、新生児では、中枢神経興奮など抗コリン作用に対する感受性が高く、痙攣などの副作用が発現した場合、重篤な症状に至る可能性が高い。

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「Ⅴ.治療に関する項目」を参照すること。

## 5. 慎重投与内容とその理由

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 [抗コリン作用による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。]                        |

(解説)

- (1)抗コリン作用により散瞳と共に房水通路の狭窄によって眼圧が上昇するおそれがある。
- (2)甲状腺機能亢進症では、交感神経系が亢進状態にあるため、抗コリン作用により頻脈、動悸、体温上昇等が増強するおそれがある。
- (3)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)抗コリン作用による心疾患系への作用により症状が増悪するおそれがあり、抗コリン作用のある薬剤は、心拍数を上昇させる等心臓への影響が考えられる。
- (5)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。

## 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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。
--------------------------------------------------------------

(解説)

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。

## 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、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。

(解説)

抗コリン作用を有する薬剤との併用投与により麻痺性イレウスが生じる可能性があるので、患者に対し、胃腸障害が生じた場合は速やかに報告するよう伝えるべきである(USP DI 26th Edit.(2006))。

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

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は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)

### (2) 重大な副作用と初期症状(頻度不明)

- 1) **ショック** 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** 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<sup>12),13)</sup>** 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。

(解説)

- 1)ショックは米国クロルフェニラミンマレイン酸塩の添付文書等を検討した結果、1996年2月より記載している。
- 2)痙攣、錯乱は米国クロルフェニラミンマレイン酸塩の添付文書等を検討した結果、1996年2月より記載している。
- 3)再生不良性貧血は1979年9月より、無顆粒球症は1980年8月より記載している。

### (3) その他の副作用

	5%以上又は頻度不明	0.1%未満
過敏症 <sup>注1)</sup>	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 <sup>注2)</sup>	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 <sup>12)</sup>	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	

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。

#### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

再評価までの資料に基づき発現頻度を記載した。

表Ⅷ-1 ポラミン錠 2mg/ポラミン散 1%の副作用発現率(再評価資料)

調査症例数	177
副作用発現例数	13 (7.34%)
副作用発現件数	14
副作用内訳	
眠気	11 (6.21%)
倦怠感	1 (0.56%)
頭重感	1 (0.56%)
下痢	1 (0.56%)

#### (5) 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

#### (6) 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)」に以下の記載あり。

〔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

「Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用と初期症状」に以下の記載あり。

- 1) ショック 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。

「Ⅷ. 8. (3) 「Ⅷ. 8. (3) その他の副作用」に以下の記載あり。

	5%以上又は頻度不明	0.1%未満
過敏症 <sup>注1)</sup>	発疹、光線過敏症等	

注1) 症状があらわれた場合には投与を中止すること。

## 9. 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ので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

(解説)

一般に高齢者では腎機能及び肝機能等の生理機能が低下しているため、本剤の血中濃度が上昇する可能性があるため、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

## 10. 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。)

(解説)

[妊婦]

・雌雄ラットに 10、20mg/kg の dH-クロルフェニラミンマレイン酸塩を交配前 8 週間経口投与した場合、両群とも薬剤によると思われる新生仔の異常は認められなかった。

[授乳婦]

- ・第一世代の抗ヒスタミン剤は抗コリン作用により乳汁分泌を阻害する。抗ヒスタミン剤の少量が乳汁中へ移行し、乳幼児の興奮作用を発現するため、使用は勧められない。(USP-DI 26th Edit. (2006))

## 11. 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。]

(解説)

低出生体重児、新生児には、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、痙攣など重篤な反応があらわれるおそれがあるので、投与しないこと。

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

<参考>

USP-DI 26th Edit. (2006) “Antihistamines (Systemic)” の項には、次の記載がある。

<アレルゲンエキシによる皮膚試験>

- ・皮膚のヒスタミン反応を抑制し、偽陰性となることがある。試験を開始する少なくとも 72 時間前に投与を中止すべきである。

## 13. 過量投与

<参考>

USP-DI 26th Edit. (2006) “Antihistamines (Systemic)” の項には、次の記載がある。

<過量投与時の症状>

- ・抗コリン作用[協調異常 (Clumsiness) 又は精神不安定 (unsteadiness)、重篤な嗜眠状態、重篤な口腔・鼻腔・咽喉の渇き、顔面潮紅 (フラッシング) 又は顔面発赤、呼吸短縮 (shortness of breath) 又は呼吸困難 (troubled breathing)]
- ・心性不整脈[動悸又は不規則な心拍 (fast of irregular heart beat) —特にアステミゾール又はテルフェナジン]
- ・中枢抑制[重篤な嗜眠状態]
- ・中枢興奮[幻覚、けいれん、睡眠障害]
- ・低血圧[ふらふら感 (feeling faint)]
- ・傾眠[眠気、異常な嗜眠状態]

注(1) 抗コリン作用と中枢興奮は小児に過量投与した場合に発現し易い。低血圧は常量を高齢者に投与した場合にも発現する可能性はある。

注(2) 上記の症状は臨床的に有意と思われるものを選択しており、これが全てではない。

<過量投与時の治療>

抗ヒスタミン剤を過量投与した時の特異的な解毒剤はないため、治療は次に示すような対症療法及び支持療法である。

- ・催吐(トコンシロップが推奨される)。吸引には注意が必要である(特に乳児・小児)。
- ・胃洗浄(等張又は 0.45% 食塩液) —服用後 3 時間以内に嘔吐しなかった場合。
- ・場合により塩類下剤(マグネシウムミルク)を使用する。
- ・低血圧には血管収縮剤を投与するが、エピネフリンはさらに血圧を下降させるため用すべきでない。
- ・酸素吸入及び補液静注
- ・中枢興奮薬の使用は痙攣誘発のおそれがあるので注意が必要である。

<過量投与例>

(1) クロルフェニラミンマレイン酸塩により 5 例(0~2 歳: 4~12mg 誤飲)の入院例を認めた報告では、3 例に胃洗浄を行っていた。胃洗浄を行っていない 2 例のうち、4mg を服用した 2 歳児では眠気のみであったが、1 日 6mg を服用した 0 歳児(生後 2 ヶ月)において、泣かない、うとうとと眠り続ける、哺乳低下、顔色不良を認めた。

(2) 8~12mg の Chlorpheniramine を投与された乳児において、幻聴・幻覚を認めたが加療により 24 時間以内に回復した例が報告されている。



## 14. 適用上の注意

<ポララミン錠2mg>

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。]

(解説)

PTP包装の薬剤に共通の注意で、PTPシートの誤飲対策として記載した。

## 15. その他の注意

該当資料なし

## 16. その他

アレルギー性鼻炎の51歳男性に対して、ポララミン復効錠(メクロルフェニラミンマレイン酸塩 6mg:販売中止)1日1錠を1週間に3~4日を約10年間服用し、再生不良性貧血が発症したとの報告がある<sup>12)</sup>。

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験(「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

#### 【局所麻酔作用】

表面麻酔(Crawford 法):モルモットの角膜上で実験を行ったところ、局所麻酔作用は塩酸コカイン=塩酸ジフェンヒドラミン>塩酸トリペレラミン>クロルフェニラミンマレイン酸塩の順であった。

浸潤麻酔(Bulbring 法):クロルフェニラミンマレイン酸塩の局所麻酔作用は塩酸プロカインとほぼ同程度であり、塩酸ジフェンヒドラミン及び塩酸トリペレナミンよりも弱かった<sup>14)</sup>。

#### 【血圧に及ぼす作用】

イヌにおいて *d* 及び *d*-H-クロルフェニラミンマレイン酸塩は 0.05mg/kg で、ヒスタミンによる血圧降下に対して強い遮断作用を示した<sup>1)</sup>。

#### 【中枢神経系に及ぼす作用】

ネコ及びマウスにおいて検討した結果、*d* 及び *d*-H-クロルフェニラミンマレイン酸塩は、同程度の一般的な中枢興奮作用を示した<sup>1)</sup>。

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験<sup>1)</sup>

表Ⅸ-1 単回投与毒性試験一覧表

(LD<sub>50</sub>:mg/kg)

動物	投与経路	経口	腹腔内	静脈内
	マウス	133	82	20
ラット	188	84	—	

(2) 反復投与毒性試験

雌雄赤毛ザルに *d*-クロルフェニラミンマレイン酸塩 20mg/kg を 1 日 1 回、8 週間経口投与した結果、体重、血液学的検査所見、血清生化学的検査、尿分析所見、臓器体重、肉眼的剖検所見及び病理学的検査所見において薬剤が関係したと思われる変化は認められなかった。

(3) 生殖発生毒性試験

ラットにおける妊娠前投与前試験で、受精率の低下が認められているが、胎仔及び新生仔への影響はみられていない。

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤:	ポララミン <sup>®</sup> 散1%	該当しない
	ポララミン <sup>®</sup> 錠2mg	該当しない
	ポララミン <sup>®</sup> シロップ0.04%	該当しない
	ポララミン <sup>®</sup> ドライシロップ0.2%	該当しない
有効成分:	メクロルフェニラミンマレイン酸塩	該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限: (外箱等に記載) 3年

(「IV. 4. 製剤の各種条件下における安定性」参照)

### 3. 貯法・保存条件

ポララミン <sup>®</sup> 散 1%	: 遮光した気密容器に入れ、室温保存
ポララミン <sup>®</sup> 錠 2mg	: 遮光した気密容器に入れ、室温保存
ポララミン <sup>®</sup> シロップ 0.04%	: 室温保存
ポララミン <sup>®</sup> ドライシロップ 0.2%	: 気密容器に入れ、室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当しない

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

「VIII. 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」及び「VIII. 14. 適用上の注意」の項参照  
・くすりのしおり: 有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

特になし

## 6. 包装

表 X-1 包装

ポララミン <sup>®</sup> 散 1%	ポララミン <sup>®</sup> 錠 2mg
バラ包装: 100g(プラスチック瓶) 500g(プラスチック瓶)	PTP 包装: 1000 錠(10 錠×100) バラ包装: 100 錠(プラスチック瓶) 1000 錠(プラスチック瓶)
ポララミン <sup>®</sup> シロップ 0.04%	ポララミン <sup>®</sup> ドライシロップ 0.2%
500mL(プラスチック瓶)	分包: 1g×1,200 包 バラ包装: 500g(プラスチック瓶)

## 7. 容器の材質

表 X-2 ポララミン<sup>®</sup>錠 2mg 及びポララミン<sup>®</sup>散 1%の容器の材質

	錠 2mg ボトル包装 100 錠	錠 2mg ボトル包装 1,000 錠	錠 2mg PTP 包装 1,000 錠	散 1% ボトル包装 100g/500g
ボトル本体	ポリエチレン	ポリエチレン	—	ポリエチレン
ボトルキャップ	ポリプロピレン	ポリプロピレン	—	ポリプロピレン
中栓	—	—	—	ポリエチレン
パッキン	ポリエチレン	ポリエチレン	—	ポリエチレン
詰め物	ポリエチレン	ポリエチレン	—	—
PTP シート	—	—	ポリ塩化ビニル アルミニウム	—
ピロー袋	—	—	アルミニウム・ポリエチレン ラミネート	—
箱	紙	紙	紙	紙

表 X-3 ポララミン<sup>®</sup>シロップ 0.04%及びポララミン<sup>®</sup>ドライシロップ 0.2%の容器の材質

	シロップ 0.04% ボトル包装 500mL	ドライシロップ 0.2% 分包包装 1g×1,200 包	ドライシロップ 0.2% ボトル包装 500g
ボトル本体	ポリエチレン	—	ポリエチレン
ボトルキャップ	アクリロニトリルブタジエンスチレン	—	ポリプロピレン
中栓	—	—	ポリエチレン
パッキン	ポリエチレン	—	ポリエチレン
分包シート	—	ポリエチレン・セロハンラミネ ート	—
ピロー袋	—	アルミニウム・ポリエチレンラ ミネート	—
箱	紙	紙	紙

## 8. 同一成分・同効薬

同一成分:ネオマレルミン錠 2mg(テバ製薬)

同効薬:ジフェンヒドラミン等のエタノールアミン系、ヒベンズ酸プロメタジン等のフェノチアジン系、ヒドロキシジン塩酸塩等のピペラジン系抗ヒスタミン剤

## 9. 国際誕生年月日

1958年 7月 29日

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販 売 名	ポララミン®散 1%	ポララミン®錠 2mg	ポララミン®シロップ 0.04%	ポララミン®ドライシロップ 0.2%
製造承認年月日	2008年 9月 29日	1968年 7月 12日	2008年 9月 29日	2008年 7月 29日
承認番号	22000AMX02158	14300AMY00240	22000AMX02159	22000AMX01794

注:

旧販売名	ポララミン®散 1%	承認年月日:	1965年 8月 4日	14000AZZ04084000
旧販売名	ポララミン®錠 2mg	承認年月日:	1959年 7月 22日	13427KUY04918000
旧販売名	ポララミン®シロップ 0.04%	承認年月日:	1963年 9月 3日	13800AZZ02816000
旧販売名	ポララミン®ドライシロップ 0.2%	承認年月日:	1986年 10月 3日	16100AMZ04351000

## 11. 薬価基準収載年月日

ポララミン®散 1%	ポララミン®錠 2mg	ポララミン®シロップ 0.04%	ポララミン®ドライシロップ 0.2%
2008年 12月 19日 (旧販売名 ポララミン散:1976年 9月 1日)	1976年 9月 1日	2008年 12月 19日 (旧販売名 ポララミンシロップ:1965年 11月 1日)	2008年 12月 19日 (旧販売名 ポララミンドライシロップ:1987年 10月 1日)

## 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

## 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

<再審査結果>

該当しない

<再評価結果>

ポララミン®散 1% :1975年 12月 26日

ポララミン®錠 2mg :1975年 12月 26日

ポララミン®シロップ 0.04% :1975年 12月 26日

## 14. 再審査期間

該当しない

## 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

## 16. 各種コード

販売名	HOT 番号(9 桁)	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
ポ ラ ラ ミ ン <sup>®</sup> 散 1 %	109354403	4419002B1033	620008734
ポ ラ ラ ミ ン <sup>®</sup> 錠 2 m g	109355103	4419002F1027	611410172
ポ ラ ラ ミ ン <sup>®</sup> シ ロ ッ プ 0.04 %	109363603	4419002Q1095	620008735
ポ ラ ラ ミ ン <sup>®</sup> ド ラ イ シ ロ ッ プ 0.2 %	109365003	4419002R1031	620008736

## 17. 保険給付上の注意

該当しない

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) Roth, F. E. et al.:J. Phar. Exp. Therap., 124(4), 347(1958) 《195820001S》
- 2) AMA:Drug Evaluations Annual(1992) 《199220002S》
- 3) 藤原和文 他:薬学雑誌, 109(1), 59(1989) 《198901622J》
- 4) 黒梅恭芳 他:小児医学, 14(2), 350(1981) 《198104002M》
- 5) Rumore, M. M. et al.:Drug Intel. Clin. Pharm. 18, 701(1984) 《198409002S》
- 6) Peets, E. A. et al.:J. Phar. Exp. Therap., 180(2), 464(1972) 《197220002S》
- 7) 谷内一彦 他:アレルギーの臨床, 22(13), 1063(2002) 《200220033S》
- 8) Eggert, M. J. et al.:社内資料 《999920243S》
- 9) Kamm, J. J. et al.:Biochem. Pharmacol, 18, 659(1969) 《196920006S》
- 10) Sharman, A. et al.:Current Drug Metabolism, 4(2), 105(2003) 《200302028S》
- 11) Dube, L. M. et al.:American Pharmaceutical Association 127th Annual Meeting  
(abstract No. 46) 10, 84(1980) 《198010004S》
- 12) Kanoh, T. et al.:Lancet, I, 546(1977) 《197703002S》
- 13) Deringer, P. M. et al.:Lancet, I, 432(1976) 《197602001S》
- 14) Labelle, A. et al.:J. Phar. Exp. Therap., 113, 72(1955) 《195520001S》

### 2. その他の参考文献

なし



## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

承認国名	承認取得年	販売名
ドイツ	1966年	POLARAMINE TABLETES 2mg
フランス	1963年	POLARAMINE SYRUP
	1961年	POLARAMINE TABLETS 2mg
イタリア	1963年	POLARAMINE SYRUP

(2007年3月現在)

### 2. 海外における臨床支援情報

#### (1) 妊婦に関する海外情報 (FDA、オーストラリア分類)

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米FDA、オーストラリア分類とは異なる。

#### 【使用上の注意】「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。]

	分類
FDA: Pregnancy Category	B (2008年11月)
オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	A (2010年4月)

参考：分類の概要

#### FDA: Pregnancy Category

B: Animal reproduction studies have failed to demonstrate a risk to the fetus and there are no adequate and well-controlled studies in pregnant women or Animal studies have shown an adverse effect, but adequate and well-controlled studies in pregnant women have failed to demonstrate a risk to the fetus in any trimester.

#### オーストラリアの分類: (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

A: Drugs which have been taken by a large number of pregnant women and women of childbearing age without any proven increase in the frequency of malformations or other direct or indirect harmful effects on the fetus having been observed.

(2) 小児等に関する記載

本邦における使用上の注意「小児等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米国の USP DI とは異なる。

【使用上の注意】「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。]

USP-DI 26th Edit. (2006) “Antihistamines (Systemic)”の項、DEXCHLORPHENIRAMINE の欄には次の記載がある。

	Usual pediatric dose
Dexchlorpheniramine Maleate Syrup USP [Polaramine] Dexchlorpheniramine Maleate Tablets USP [Polaramine]	Antihistaminic (H <sub>1</sub> -receptor) – Children up to 12 years of age: Oral, 150 mcg (0.15 mg) per kg of body weight or 4.5 mg per square meter of body surface per day, in four divided doses or for Children 2 to 5 years of age: Oral, 500 mcg (0.5 mg) every four to six hours as needed. Children 5 to 12 years of age: Oral, 1 mg every four to six hours as needed.  Note: Premature and full-term neonates – Use is not recommended.

## XIII 備考

### その他の関連資料

該当資料なし

製造販売

**高田製薬株式会社**

さいたま市西区宮前町203番地1