

貯法：室温保存

有効期間：3年

承認番号	30100AMX00330
販売開始	1978年4月

持続性抗ヒスタミン剤  
シロップ用クレマスチンフマル酸塩

劇薬<sup>※</sup>

# クレマスチンDS0.1%「タカタ」

Clemastine Dry Syrup “TAKATA”



※分包品は除く

## 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 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。〕
- 2.3 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。〕
- 2.4 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。〕

## 3. 組成・性状

### 3.1 組成

有効成分	添加剤
1g中 日局 クレマスチンフマル酸塩 1.34mg (クレマスチンとして1mg)	D-マンニトール、精製白糖、シヨ糖脂肪酸エステル、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、香料

### 3.2 製剤の性状

性状
白色の細粒で、芳香がある。味は甘い。

## 4. 効能又は効果

- アレルギー性皮膚疾患（蕁麻疹、湿疹、皮膚炎、そう痒症）
- 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

## 6. 用法及び用量

通常、成人は1日量2g（クレマスチンとして2mg）を2回に分け、用時溶解して経口投与する。  
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。  
幼児に対しては、標準的な用量として下記の1日量を2回に分け、用時溶解して経口投与する。

年齢	幼児の1日用量
1歳以上3歳未満	0.4g
3歳以上5歳未満	0.5g
5歳以上8歳未満	0.7g
8歳以上11歳未満	1.0g
11歳以上15歳未満	1.3g

なお、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。

## 8. 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従事させないよう十分注意すること。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

- 9.1 合併症・既往歴等のある患者
  - 9.1.1 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。
  - 9.1.2 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。

## 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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のみ投与すること。

## 9.6 授乳婦

授乳を避けさせること。母乳中へ移行することが報告されている。〔9.7 参照〕

## 9.7 小児等

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。〔9.6、11.1.1 参照〕

## 9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

## 10. 相互作用

### 10.2 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。

## 11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

### 11.1 重大な副作用

#### 11.1.1 痙攣（頻度不明）、興奮（頻度不明）

乳児、幼児では特に注意すること。〔9.7 参照〕

#### 11.1.2 肝機能障害（頻度不明）、黄疸（頻度不明）

AST、ALT、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。

### 11.2 その他の副作用

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

## 13. 過量投与

### 13.1 症状

中枢神経抑制、興奮、口渇、瞳孔散大、潮紅、胃腸症状等

## 14. 適用上の注意

### 14.1 薬剤交付時の注意

幼児の手の届かない所に保管すること。

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

#### 16.1.1 単回投与

<sup>3</sup>H-クレマスチン 2mg を経口投与したところ、4 時間後に最高血中濃度を示した<sup>1)</sup>。

#### 16.1.2 生物学的同等性試験

生物学的同等性試験において、クレマスチン DS0.1% 「タカタ」はタベジールシロップ 0.01% との生物学的同等性が確認された。クロスオーバー法により、健康成人男子 20 名にクレマスチン DS0.1% 「タカタ」2g (クレマスチンとして 2mg) を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 1、2、3、4、5、7、12、24 及び 48 時間に前腕静脈から採血した。GC/MS 法により測定した「クレマスチンフマル酸塩+代謝物」の血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、AUC 及び Cmax について統計的評価を行った<sup>2)</sup>。

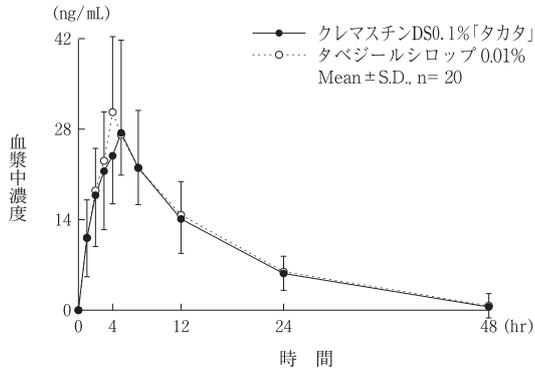


図 16-1 血漿中濃度

表 16-1 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
クレマスチン DS0.1% 「タカタ」	419.00±100.51	31.44±14.03	4.6±1.1	11.8±7.6
タベジールシロップ 0.01%	441.44±123.63	31.73±11.30	4.2±0.7	11.1±4.8

(Mean ± S.D., n=20)

血漿中濃度並びに 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。

#### 16.5 排泄

投与後 120 時間までの尿中排泄率は 45%、糞便中排泄率は 19%であった<sup>1)</sup>。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

クレマスチンフマル酸塩はベンツヒドリルエーテル系に属する抗ヒスタミン剤の製剤で、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<sup>3)</sup>。

### 18.2 薬理作用

18.2.1 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 (*in vitro*)、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>4)</sup>。

18.2.2 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疹誘起に対するクレマスチン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>5)</sup>。

18.2.3 抗ヒスタミン作用を示す用量では、鎮静作用 (サル)<sup>4)、6)</sup>、抗コリン作用 (モルモット回腸、*in vitro*)<sup>4)</sup>、抗セロトニン作用 (ラット子宮、*in vitro*)<sup>4)</sup>及び抗アドレナリン作用 (イヌ)<sup>4)、6)</sup>は弱い。

### 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般の名称：クレマスチンフマル酸塩  
(Clemastine Fumarate)

化学名：(2*R*)-2-[2-[(1*R*)-1-(4-Chlorophenyl)-1-phenylethoxy]ethyl]-1-methylpyrrolidine monofumarate

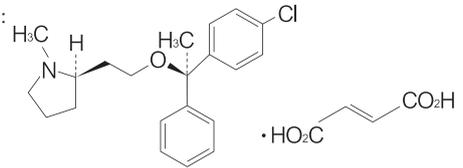
分子式：C<sub>21</sub>H<sub>26</sub>ClNO・C<sub>4</sub>H<sub>4</sub>O<sub>4</sub>

分子量：459.96

性状：白色の結晶性の粉末で、においはない。

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。

化学構造式：



融点：176~180℃(分解)

旋光度：[α]<sub>D</sub><sup>20</sup>：+16~+18° (乾燥後、0.1g、メタノール、10mL、100mm)

## 22. 包装

0.5g×400包 [分包、乾燥剤入り]

1g×200包 [分包、乾燥剤入り]

100g [プラスチック瓶、バラ、乾燥剤入り]

500g [プラスチック瓶、バラ、乾燥剤入り]

## 23. 主要文献

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編：第十八改正 日本薬局方解説書 2021：C-1700-1704
- 2) 社内資料：生物学的同等性試験 (クレマスチン DS0.1% 「タカタ」)
- 3) 長谷川誠他：新薬と臨床.1973；22 (2)：323-326
- 4) Weidmann,H. et al. :Boll.Chim.Farm.,1967;106 (7) :467-496
- 5) Kerp,L. et al. : Med. Welt.,1966；17：2794-2798
- 6) Römer,D. et al. : Med. Welt. 1966；17：2791-2794

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

高田製薬株式会社 文献請求窓口

〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

**高田製薬株式会社**

さいたま市西区宮前町203番地1