

抗アレルギー剤

ペリアクチン[®]錠

ペリアクチン[®]散 1%

Periactin[®]

Tablets・1%Powder

塩酸シプロヘプタジン錠・散 1%

散 1%：劇薬，指定医薬品

貯法：室温保存

使用期間：5 年

使用期限：外箱に表示

【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) 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】

販売名		ペリアクチン [®] 錠	ペリアクチン [®] 散 1%
剤形・色調		円形・裸錠・白色	散剤・白色
有効成分の名称		日本薬局方 塩酸シプロヘプタジン	
含 量 (無水物として)		4mg	1g 中に10mg
添加物		リン酸水素 Ca, 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 Mg	乳糖
外形	表面	 直径：8.0mm	――
	裏面		――
	側面	 厚さ：2.8mm	――
識別コード		NMB 62	――

【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】

塩酸シプロヘプタジンとして，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、喘息の悪化また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）

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。

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

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（いずれも頻度不明）
- 2) 痙攣（頻度不明）
- 3) 無顆粒球症（頻度不明）：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。

種類／頻度	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 ⁸ 、注意力低下、いら いら感、興奮、運動失調	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、ALP 上昇、LDH 上昇等）	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ので、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。

(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。

8. 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。

9. 適用上の注意

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。〕

【薬物動態】

外国人のデータでは、健康成人2名に¹⁴C-塩酸シプロヘプタジン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%だった。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、散1%、シロップ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

塩酸シプロヘプタジン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

塩酸シプロヘプタジン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：塩酸シプロヘプタジン（Cyproheptadine hydrochloride）

化学名：4-(5H-Dibenzo [a,d] cyclohepten-5-ylidene)-1-methylpiperidine monohydrochloride sesquihydrate

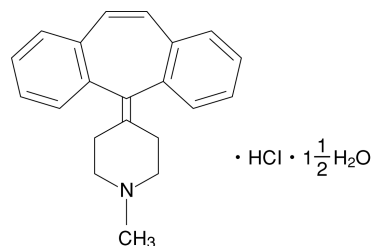
分子式： $C_{21}H_{21}N \cdot HCl \cdot 1\frac{1}{2}H_2O$

分子量：350.88

融点：252～257℃

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。

構造式：



【包装】

1錠4mg：PTP 500錠（10錠×50）

瓶 500錠

散1g中10mg：瓶 500g

【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) 鷹野研一 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・製品情報お問い合わせ先】

万有製薬株式会社 情報サービスセンター
〒103-8416 東京都中央区日本橋本町2-2-3
医師、病院薬剤師の方：フリーダイヤル0120-024-961
保険薬局薬剤師の方：フリーダイヤル0120-024-962
<受付時間>9:00～18:00（土日祝日・当社休日を除く）



製造発売元 萬有製薬株式会社

〒103-8416 東京都中央区日本橋本町 2-2-3 電話 03(5203)8111

® Trademark of Merck & Co., Inc.
Whitehouse Station, N.J., U.S.A.

7495-74

