2026 年 10 月改訂(第 8 版)

日本標準商品分類番号
874419

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 2018(2019 年更新版)に準拠して作成

抗ヒスタミン剤

処方箋医薬品

日本薬局方

クロルフェニラミンマレイン酸塩注射液

ビスミラー®注5mg

Bismilla Injection

剤形	水性注射剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1 管中 日局 クロルフェニラミンマレイン酸塩（*dl*-体）5mg
一般名	和名：クロルフェニラミンマレイン酸塩（JAN） 洋名：Chlorpheniramine Maleate（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2006 年 7 月 24 日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：1958 年 10 月 1 日 販売開始年月日：1958 年 10 月 1 日
製造販売（輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元：扶桑薬品工業株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	扶桑薬品工業株式会社　くすり相談室 TEL 0800-800-6363（フリーアクセス）　FAX 06-6969-2361 （9:00～17:30/土日祝日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.fuso-pharm.co.jp/med/ph/

本ＩＦは 2026 年 10 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。
最新の電子添文情報は、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。

医薬品インタビューフォーム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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、ＭＲ）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、ＩＦと略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第 2 小委員会がＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第 3 小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会がＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領 2008 以降、ＩＦはＰＤＦ等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦは、医薬品医療機器総合機構（以下、ＰＭＤＡ）の医療用医薬品情報検索のページ

（http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品のＩＦの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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･検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「ＩＦ記載要領 2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため，その更新版を策定した。

2. ＩＦとは

ＩＦは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし，製薬企業での製本は必須ではない。

3. ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは、ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索の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ＩＦを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、ＩＦの使用にあたっては、最新の添付文書をＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。ＩＦは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、ＭＲ等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがＩＦの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、ＩＦを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

（2020 年 4 月）

目　次

Ⅰ．概要に関する項目 …… 1
Ⅰ－1　開発の経緯 …… 1
Ⅰ－2　製品の治療学的特性 …… 1
Ⅰ－3　製品の製剤学的特性 …… 1
Ⅰ－4　適正使用に関して周知すべき特性 …… 1
Ⅰ－5　承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 1
(1)承認条件 …… 1
(2)流通・使用上の制限事項 …… 1
Ⅰ－6　RMP の概要 …… 1

Ⅱ．名称に関する項目 …… 2
Ⅱ－1　販売名 …… 2
(1)和名 …… 2
(2)洋名 …… 2
(3)名称の由来 …… 2
Ⅱ－2　一般名 …… 2
(1)和名(命名法) …… 2
(2)洋名(命名法) …… 2
(3)ステム …… 2
Ⅱ－3　構造式又は示性式 …… 2
Ⅱ－4　分子式及び分子量 …… 2
Ⅱ－5　化学名(命名法)又は本質 …… 2
Ⅱ－6　慣用名，別名，略号，記号番号 …… 2

Ⅲ．有効成分に関する項目 …… 3
Ⅲ－1　物理化学的性質 …… 3
(1)外観・性状 …… 3
(2)溶解性 …… 3
(3)吸湿性 …… 3
(4)融点(分解点)，沸点，凝固点 …… 3
(5)酸塩基解離定数 …… 3
(6)分配係数 …… 3
(7)その他の主な示性値 …… 3
Ⅲ－2　有効成分の各種条件下における安定性 …… 3
Ⅲ－3　有効成分の確認試験法，定量法 …… 3

Ⅳ．製剤に関する項目 …… 4
Ⅳ－1　剤形 …… 4
(1)剤形の区別 …… 4
(2)製剤の外観及び性状 …… 4
(3)識別コード …… 4
(4)製剤の物性 …… 4
(5)その他 …… 4
Ⅳ－2　製剤の組成 …… 4
(1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤 …… 4
(2)電解質等の濃度 …… 4
(3)熱量 …… 4
Ⅳ－3　添付溶解液の組成及び容量 …… 4
Ⅳ－4　力価 …… 4
Ⅳ－5　混入する可能性のある夾雑物 …… 4
Ⅳ－6　製剤の各種条件下における安定性 …… 5
Ⅳ－7　調製法及び溶解後の安定性 …… 5
Ⅳ－8　他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 5
Ⅳ－9　溶出性 …… 5
Ⅳ－10　容器・包装 …… 5
(1)注意が必要な容器・包装，外観が特殊な容器・包装に関する情報 …… 5
(2)包装 …… 5
(3)予備容量 …… 5
(4)容器の材質 …… 5
Ⅳ－11　別途提供される資材類 …… 5
Ⅳ－12　その他 …… 6

Ⅴ．治療に関する項目 …… 7
Ⅴ－1　効能又は効果 …… 7
Ⅴ－2　効能又は効果に関連する注意 …… 7
Ⅴ－3　用法及び用量 …… 7
(1)用法及び用量の解説 …… 7
(2)用法及び用量の設定経緯・根拠 …… 7
Ⅴ－4　用法及び用量に関連する注意 …… 7
Ⅴ－5　臨床成績 …… 7
(1)臨床データパッケージ …… 7
(2)臨床薬理試験 …… 7
(3)用量反応探索試験 …… 7
(4)検証的試験 …… 7
1)有効性検証試験 …… 7
2)安全性試験 …… 7
(5)患者・病態別試験 …… 7
(6)治療的使用 …… 8
1)使用成績調査（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容 … 8
2)承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要 …… 8
(7)その他 …… 8

Ⅵ．薬効薬理に関する項目 …… 9
Ⅵ－1　薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 … 9
Ⅵ－2　薬理作用 …… 9
(1)作用部位・作用機序 …… 9
(2)薬効を裏付ける試験成績 …… 9
(3)作用発現時間・持続時間 …… 9

Ⅶ．薬物動態に関する項目 …… 10
Ⅶ－1　血中濃度の推移 …… 10
(1)治療上有効な血中濃度 …… 10
(2)臨床試験で確認された血中濃度 …… 10
(3)中毒域 …… 10
(4)食事・併用薬の影響 …… 10
Ⅶ－2　薬物速度論的パラメータ …… 10
(1)解析方法 …… 10
(2)吸収速度定数 …… 10
(3)消失速度定数 …… 10
(4)クリアランス …… 10
(5)分布容積 …… 10
(6)その他 …… 10
Ⅶ－3　母集団(ポピュレーション)解析 …… 10
(1)解析方法 …… 10
(2)パラメータ変動要因 …… 10
Ⅶ－4　吸収 …… 11

Ⅶ-５ 分布 11
(1)血液－脳関門通過性 11
(2)血液－胎盤関門通過性 11
(3)乳汁への移行性 11
(4)髄液への移行性 11
(5)その他の組織への移行性 11
(6)血漿蛋白結合率 11
Ⅶ-６ 代謝 11
(1)代謝部位及び代謝経路 11
(2)代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種，寄与率 11
(3)初回通過効果の有無及びその割合 11
(4)代謝物の活性の有無及び活性比，存在比率 11
Ⅶ-７ 排泄 12
Ⅶ-８ トランスポーターに関する情報 12
Ⅶ-９ 透析等による除去率 12
Ⅶ-10 特定の背景を有する患者 12
Ⅶ-11 その他 12

Ⅷ．安全性(使用上の注意等)に関する項目 13
Ⅷ-１ 警告内容とその理由 13
Ⅷ-２ 禁忌内容とその理由 13
Ⅷ-３ 効能又は効果に関連する注意とその理由 13
Ⅷ-４ 用法及び用量に関連する注意とその理由 13
Ⅷ-５ 重要な基本的注意とその理由 13
Ⅷ-６ 特定の背景を有する患者に関する注意 13
(1)合併症・既往歴等のある患者 13
(2)腎機能障害患者 13
(3)肝機能障害患者 14
(4)生殖能を有する者 14
(5)妊婦 14
(6)授乳婦 14
(7)小児等 14
(8)高齢者 14
Ⅷ-７ 相互作用 14
(1)併用禁忌とその理由 14
(2)併用注意とその理由 15
Ⅷ-８ 副作用 15
(1)重大な副作用と初期症状 15
(2)その他の副作用 15
Ⅷ-９ 臨床検査結果に及ぼす影響 16
Ⅷ-10 過量投与 16
Ⅷ-11 適用上の注意 16
Ⅷ-12 その他の注意 16
(1)臨床使用に基づく情報 16
(2)非臨床試験に基づく情報 16

Ⅸ．非臨床試験に関する項目 17
Ⅸ-１ 薬理試験 17
(1)薬効薬理試験 17
(2)安全性薬理試験 17
(3)その他の薬理試験 17
Ⅸ-２ 毒性試験 17
(1)単回投与毒性試験 17
(2)反復投与毒性試験 17
(3)遺伝毒性試験 17
(4)がん原性試験 17
(5)生殖発生毒性試験 17
(6)局所刺激性試験 17
(7)その他の特殊毒性 17

Ⅹ．管理的事項に関する項目 18
Ⅹ-１ 規制区分 18
Ⅹ-２ 有効期間 18
Ⅹ-３ 包装状態での貯法 18
Ⅹ-４ 取扱い上の注意 18
Ⅹ-５ 患者向け資材 18
Ⅹ-６ 同一成分・同効薬 18
Ⅹ-７ 国際誕生年月日 18
Ⅹ-８ 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日 18
Ⅹ-９ 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 18
Ⅹ-10 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 19
Ⅹ-11 再審査期間 19
Ⅹ-12 投薬期間制限に関する情報 19
Ⅹ-13 各種コード 19
Ⅹ-14 保険給付上の注意 19

ⅩⅠ．文献 20
ⅩⅠ-１ 引用文献 20
ⅩⅠ-２ その他の参考文献 20

ⅩⅡ．参考資料 21
ⅩⅡ-１ 主な外国での発売状況 21
ⅩⅡ-２ 海外における臨床支援情報 21

ⅩⅢ．備考 22
ⅩⅢ-１ 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 22
(1)粉砕 22
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 22
ⅩⅢ-２ その他の関連資料 22

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

Sperber、Papa、Schwenk らの研究により 1947 年に初めて合成され、Tislow らによってその生理作用が報告された。抗ヒスタミン薬中最も作用が強く、副作用の少ないものの一つである[1)]。

「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成 12 年 9 月 19 日医薬発第 935 号）により、2006 年 7 月 24 日付で、ビスミラー注射液からビスミラー注 5 ㎎へ販売名変更の承認を受けた。

２．製品の治療学的特性

・本剤はヒスタミン H_1 受容体遮断薬であり、H_1 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[1)]。（Ⅵ-2.の項 参照）

・抗コリン作用により閉塞隅角緑内障の患者及び前立腺肥大等下部尿路に閉塞性疾患のある患者が禁忌とされている。（Ⅷ-2.の項 参照）

・重大な副作用として、ショック、痙攣、錯乱、再生不良性貧血、無顆粒球症があらわれることが報告されている。（Ⅷ-8.の項 参照）

３．製品の製剤学的特性

特になし

４．適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材，最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

５．承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1)承認条件

特になし

(2)流通・使用上の制限事項

特になし

６．RMP の概要

該当しない（RMP 策定対象外の事例）

Ⅱ．名称に関する項目

１．販売名

(1)和名

ビスミラー®注 5mg

(2)洋名

Bismilla Injection

(3)名称の由来

特になし

２．一般名

(1)和名(命名法)

クロルフェニラミンマレイン酸塩（JAN）

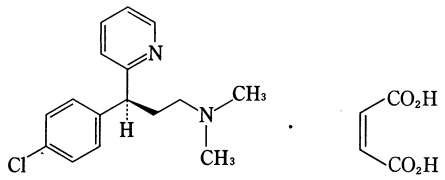
(2)洋名(命名法)

Chlorpheniramine Maleate（JAN）

(3)ステム

該当しない

３．構造式又は示性式



及び鏡像異性体

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)又は本質

(3*RS*)-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

Ⅲ．有効成分に関する項目

１．物理化学的性質

(1)外観・性状

白色の微細な結晶である。

(2)溶解性

酢酸（100）に極めて溶けやすく、水又はメタノールに溶けやすく、エタノール（99.5）にやや溶けやすい。希塩酸に溶ける。

(3)吸湿性

該当資料なし

(4)融点(分解点)，沸点，凝固点

融点：130～135℃

(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

比吸光度 $E_{1cm}^{1\%}$（265nm）[1)]：215

pH：1.0g を新たに煮沸して冷却した水 100mL に溶かした液の pH は 4.0～5.5 である。

水溶液（1→20）は、旋光性を示さない。

２．有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

３．有効成分の確認試験法，定量法

確認試験法

1）紫外可視吸光度測定法

2）赤外吸収スペクトル測定法

3）薄層クロマトグラフィー

定量法

過塩素酸滴定法

Ⅳ. 製剤に関する項目

１．剤形

(1)剤形の区別

水性注射剤

(2)製剤の外観及び性状

無色澄明の液

(3)識別コード

該当しない

(4)製剤の物性

pH：4.5～7.0

浸透圧比（生理食塩液に対する比）：0.9～1.1

(5)その他

特になし

２．製剤の組成

(1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

有効成分：1管中　日局　クロルフェニラミンマレイン酸塩（*dl*-体）5mg

添加剤：無痛化剤　ベンジルアルコール　5mg

　　等張化剤　塩化ナトリウム

(2)電解質等の濃度

該当資料なし

(3)熱量

該当資料なし

３．添付溶解液の組成及び容量

該当しない

４．力価

該当しない

５．混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

長期保存試験

保存条件	保存期間	保存形態	結　果
25℃±2℃ 60%RH±5%RH	3年	最終包装	変化なし

光安定性試験 [2)]

保存条件	保存形態	結　果
約2500lxで総照度として206万lx・hr 総近紫外放射エネルギー200W・h/㎡以上 室温保存	直接容器	変化なし

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

アルカリ性の注射剤との混合で混濁などの外観変化を生じやすい。塩化カルシウム、KM（カナマイシン硫酸塩）と注射筒中で混合しないこと。IV line中への注入は避け直接静注すること [3)]。
（配合変化試験はⅩⅢ-2.の項 参照）

＜pH変動スケール＞

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)						0.2mL→ (0.1mol/L NaOH)		白濁					

1.18　　4.95（試料pH）　8.82

9. 溶出性

該当資料なし

10. 容器・包装

(1)注意が必要な容器・包装，外観が特殊な容器・包装に関する情報

Ⅹ-4.の項 参照

(2)包装

1mL　50管　ガラスアンプル

(3)予備容量

該当しない

(4)容器の材質

ガラス

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

特になし

Ⅴ．治療に関する項目

１．効能又は効果

蕁麻疹、枯草熱、皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、薬疹、咬刺症）、アレルギー性鼻炎、血管運動性鼻炎

２．効能又は効果に関連する注意

設定されていない

３．用法及び用量

(1)用法及び用量の解説

dl-クロルフェニラミンマレイン酸塩として、通常成人1回5～10mgを1日1～2回、皮下、筋肉内又は静脈内注射する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

(2)用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

４．用法及び用量に関連する注意

設定されていない

５．臨床成績

(1)臨床データパッケージ

該当しない

(2)臨床薬理試験

該当資料なし

(3)用量反応探索試験

該当資料なし

(4)検証的試験

1)有効性検証試験

該当資料なし

2)安全性試験

該当資料なし

(5)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（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容

該当しない

2)承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7)その他

特になし

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

１．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

クロルフェニラミン類（*d*-クロルフェニラミンマレイン酸塩）

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

２．薬理作用

(1)作用部位・作用機序

ヒスタミンH_1受容体遮断薬。H_1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[1)]。

(2)薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3)作用発現時間・持続時間

Ⅶ-1.の項 参照

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

１．血中濃度の推移

(1)治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2)臨床試験で確認された血中濃度

ヒト（健康外国人）に ^{3}H 標識クロルフェニラミンマレイン酸塩 4mg を静脈内投与した場合、投与 5 分後に最高血中濃度に達し、その値はクロルフェニラミン 14.89mμg/mL に相当し、半減期はα相が 15 分、β相が 28 時間である[4)]。

(3)中毒域

該当資料なし

(4)食事・併用薬の影響

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

該当資料なし

(3)消失速度定数

該当資料なし

(4)クリアランス

該当資料なし

(5)分布容積

該当資料なし

(6)その他

特になし

３．母集団(ポピュレーション)解析

(1)解析方法

該当資料なし

(2)パラメータ変動要因

該当資料なし

４．吸収

該当しない

５．分布

(1)血液-脳関門通過性

通過する（クロルフェニラミン）[5)]

(2)血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

(3)乳汁への移行性

該当資料なし

(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

動物実験において、クロルフェニラミンマレイン酸塩の急速静注により、速やかに各組織に取り込まれる。その分布パターンは脳（視床下部に最も多く分布）と副腎への移行が大きく、副腎においてはその消失も他の組織に比べ遅い[5)]。

(6)血漿蛋白結合率

0.28μg/mL、1.24μg/mL の血漿濃度でそれぞれ 72%、69%（*in vitro*）[4)]

６．代謝

(1)代謝部位及び代謝経路

代謝部位：肝臓

^{3}H 標識クロルフェニラミンマレイン酸塩は、その大部分が非極性化合物（monodesmethyl-chlorpheniramine と didesmethyl-chlorpheniramine）と極性化合物に代謝される[4)]。

(2)代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種，寄与率

該当資料なし

(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活性比，存在比率

該当資料なし

７．排泄

排泄部位：主に腎臓[4)]

排泄率：ヒト（健康外国人）への ^{3}H 標識クロルフェニラミンマレイン酸塩の 4mg 静脈内投与では投与 48 時間後の尿中回収率は投与量の 36%であり、糞便中への排泄は 0.2%である[4)]。

８．トランスポーターに関する情報

該当資料なし

９．透析等による除去率

血液透析：除去されるとの報告がある[6)]。

10．特定の背景を有する患者

該当資料なし

11．その他

特になし

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 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

2.2 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困難、尿閉等があらわれ、症状が増悪することがある。］

2.4 低出生体重児、新生児［9.7.1 参照］

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 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。

8.2 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、血液検査を行うこと。［11.1.3 参照］

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

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 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。

9.1.2 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。

9.1.3 甲状腺機能亢進症の患者

抗コリン作用により症状が増悪するおそれがある。

9.1.4 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。

9.1.5 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。

9.1.6 高血圧症の患者

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。

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3)肝機能障害患者

設定されていない

(4)生殖能を有する者

設定されていない

(5)妊婦

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にのみ投与すること。

(6)授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7)小児等

9.7 小児等

9.7.1 低出生体重児、新生児

投与しないこと。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。[2.4参照]

9.7.2 乳児、幼児及び小児

乳児、幼児及び小児を対象とした臨床試験は実施していない。

(8)高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

7. 相互作用

(1)併用禁忌とその理由

設定されていない

(2)併用注意とその理由

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 バルビツール酸系薬剤等 アルコール	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。	本剤の中枢抑制作用により、作用が増強される。
モノアミン酸化酵素阻害剤		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。
抗コリン作動性薬剤 ブチルスコポラミン臭化物 アトロピン硫酸塩水和物等		機序は不明である。
ドロキシドパ ノルアドレナリン	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。

8．副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 **ショック**（頻度不明）

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。

11.1.2 **痙攣、錯乱**（いずれも頻度不明）

11.1.3 **再生不良性貧血、無顆粒球症**（いずれも頻度不明）

［8.2 参照］

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	頻度不明
過敏症	発疹、光線過敏症
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
消化器	口渇、胸やけ、食欲不振、悪心・嘔吐、腹痛、便秘、下痢
泌尿器	頻尿、排尿困難、尿閉
循環器	低血圧、心悸亢進、頻脈、期外収縮、微弱脈
呼吸器	鼻及び気道の乾燥、気管分泌液の粘性化、喘鳴、鼻閉
血液	溶血性貧血、血小板減少
肝臓	肝機能障害（AST、ALT、AL-P の上昇）
その他	悪寒、発汗異常、疲労感、胸痛、月経異常、顔面蒼白

９．臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 注射部位に一過性の刺激、灼熱感があらわれることがある。

14.1.2 皮下・筋肉内注射時

組織・神経などへの影響を避けるため、以下の点に配慮すること。

・神経走行部位を避けるよう注意すること。

・注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。

・繰返し注射する場合には、注射部位を変え、たとえば左右交互に注射するなど配慮すること。なお、乳児、幼児、小児には連用しないことが望ましい。

＜参考＞

アンプルカット時:安全に使用するため、従来どおりエタノール綿等で清拭することが望ましい。

12. その他の注意

(1)臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2)非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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

クロルフェニラミンマレイン酸塩の LD_{50}（mg/kg）は次表のとおりである[7]。

	経　口	皮　下	腹腔内	静脈内
マウス	142.0	104.0	76.7	39.6
モルモット	198.0	101.1	－	－

(2) 反復投与毒性試験

イヌに 1 日 0.42～7mg/kg（塩基として）を最長 250 日間経口投与した結果、投与量の増加とともに生存日数の短縮がみられ、また 3.5mg/kg を 6 ヵ月間投与した例の剖検で、軽度の腹部臓器の充血及び胃・十二指腸粘膜のびらんがみられたが、血液学的変化は認められていない[7]。

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
有効成分：該当しない

２．有効期間

3 年

３．包装状態での貯法

室温保存

４．取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意
外箱開封後は遮光して保存すること。

５．患者向け資材

くすりのしおり：あり
英語版くすりのしおり：あり
患者向医薬品ガイド：なし

６．同一成分・同効薬

同一成分薬：アレルギン散 1%（アルフレッサファーマ）　等
同　効　薬：*d*-クロルフェニラミンマレイン酸塩　等

７．国際誕生年月日

不明

８．製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日

製造販売承認年月日：2006 年 7 月 24 日（販売名変更による）
承認番号：21800AMX10589
薬価基準収載年月日：1958 年 10 月 1 日
販売開始年月日：1958 年 10 月 1 日

９．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

Ⅹ-10.の項 参照

10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：1975 年 12 月 26 日

内容：

	変　更　前
効能・効果	感冒、鼻炎、じんましん、湿疹、皮膚瘙痒症、喘息などのアレルギー性疾患および乗り物酔。
用法・用量	通常成人 1 回 1 管 1mL を 1 日 1～3 回皮下または筋肉内に注射します。 ▽常用量：1 回 2～10mg（皮下、筋肉）

変更後の効能・効果はⅤ-1.、用法・用量はⅤ-3.の項を参照。

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	レセプト電算コード
109415203	4419401A2016	4419401A2083	641410017 (620004409)

注：統一名収載品において、レセプト電算コード欄の（　　）内は銘柄名コードを示す。

14. 保険給付上の注意

特になし

ＸＩ．文　献

１．引用文献

1) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店.2021：C-1832-1838
2) 扶桑薬品工業株式会社（光安定性試験）社内資料
3) 福嶋豁行 ほか：注射剤の配合変化 第二版，エフ・コピント・富士書院. 2002：2116-2119
4) Peets EA, et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther. 1972；180：464-474
5) 桜井 栄一 ほか：薬物動態. 1987；2：452-453
6) Rumore MM.：Drug Intell. Clin. Pharm. 1984；18：701-707
7) LaBelle A, et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther. 1955；113：72-88

２．その他の参考文献

該当資料なし

ＸⅡ．参考資料

１．主な外国での発売状況

(1)本剤と同一製剤は外国で発売されていない。

(2)クロルフェニラミンマレイン酸塩製剤としては、各国で発売されている。(2026 年 10 月時点)

２．海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備　考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉砕

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

配合変化試験

扶桑薬品工業株式会社が製造・販売している輸液製剤 19 品目との配合変化試験を実施した。輸液製剤の 1 容器に対して、ビスミラー注 5mg を 1 管(1mL)としてシリンジに吸い取り、各々混合した。配合直後、1、3、6、24 時間後の外観および pH を観察した(散光下、室温)。経時的に外観変化のあるものは、最初に変化が認められた時点を変化点とした。(試験実施：2003 年、2017 年、2024 年)

表　ビスミラー注 5mg の配合変化試験

輸液		開始時	1 時間後	3 時間後	6 時間後	24 時間後	変化要約
アクチット輸液 200mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	5.45	5.46	5.46	5.45	5.46	
アルトフェッド注射液 200mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	5.37	5.38	5.38	5.39	5.37	
ヴィーン 3G 輸液 500mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	5.43	5.43	5.43	5.42	5.43	
ヴィーン D 輸液 200mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	5.44	5.44	5.44	5.43	5.44	
ヴィーン F 輸液 500mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	6.88	6.84	6.84	6.84	6.86	
ｷｼﾘﾄｰﾙ注 5%「ﾌｿｰ」 200mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	5.52	5.51	5.51	5.54	5.55	
クリニザルツ輸液 500mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	5.65	5.65	5.65	5.65	5.65	
グルアセト 35 注 250mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	5.05	5.05	5.05	5.05	5.05	
生理食塩液 PL「フソー」 200mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	5.20	5.22	5.23	5.22	5.24	
ﾊﾙﾄﾏﾝ D 液「ﾌｿｰ」 500mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	4.57	4.58	4.58	4.57	4.58	
ハルトマン-G3 号輸液 200mL	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
	pH	5.16	5.17	5.17	5.16	5.17	

ⅩⅢ. 備考

輸液		開始時	1時間後	3時間後	6時間後	24時間後	変化要約
ブドウ糖注5%PL「フソー」	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
200mL	pH	5.40	5.26	5.29	5.33	5.31	
マルトース輸液10%「フソー」	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
200mL	pH	5.28	5.07	5.11	5.11	5.11	
ラクトリンゲル液〝フソー〟	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
200mL	pH	6.02	6.02	6.02	6.03	6.02	
ラクトリンゲルM注「フソー」	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
200mL	pH	5.23	5.23	5.24	5.24	5.23	
ラクトリンゲルS注「フソー」	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
200mL	pH	5.86	5.87	5.87	5.87	5.87	
リプラス1号輸液	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
200mL	pH	5.16	5.16	5.16	5.16	5.15	
リプラス3号輸液	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
200mL	pH	5.15	5.16	5.16	5.17	5.15	
リンゲル液「フソー」	外観	無色澄明	←	←	←	←	外観変化なし
500mL	pH	5.50	5.47	5.46	5.44	5.52	

注）残存率による評価は行っていない。
配合変化の評価については、本試験以外にpH変動試験等を併せて考慮する必要がある。
また、試験条件により、今回と同一薬剤の組み合わせであっても、結果が異なる場合が考えられる。