2025年4月作成（第1版）

日本標準商品分類番号　872229

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

鎮咳剤

クロペラスチン塩酸塩錠

フスタゾール糖衣錠10mg

HUSTAZOL SUGAR-COATED Tablets

鎮咳剤

クロペラスチンフェンジゾ酸塩散

フスタゾール散10%

HUSTAZOL Powder

鎮咳剤

日本薬局方 クロペラスチンフェンジゾ酸塩錠

フスタゾール錠小児用2.5mg

HUSTAZOL Tablets for Children

剤形	フスタゾール糖衣錠10mg：糖衣錠 フスタゾール散10%：散剤 フスタゾール錠小児用2.5mg：錠剤			
製剤の規制区分	該当しない			
規格・含量	糖衣錠：1錠中　日局　クロペラスチン塩酸塩　10mg含有 散：1g中　日局　クロペラスチンフェンジゾ酸塩　177mg含有 （クロペラスチン塩酸塩として100mg） 錠小児用：1錠中　日局　クロペラスチンフェンジゾ酸塩　4.4mg含有 （クロペラスチン塩酸塩として2.5mg）			
一般名	和名（洋名） 糖衣錠：クロペラスチン塩酸塩（Cloperastine Hydrochloride）（JAN） 散・錠小児用：クロペラスチンフェンジゾ酸塩（Cloperastine Fendizoate）（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 （販売名変更に伴う再承認）	薬価基準収載年月日 （変更銘柄名での収載日）	販売開始年月日
	糖衣錠	2009年7月　1日	2009年9月25日	1966年1月21日
	散	2002年3月11日	2002年7月　5日	1966年1月21日
	錠小児用	2009年6月26日	2009年9月25日	1972年4月17日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ニプロ 株式会社			
医薬情報担当者の連絡先				
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社　医薬品情報室 TEL：0120-226-898　FAX：050-3535-8939 医療関係者向けホームページ https://www.nipro.co.jp/			

本IFは2025年4月作成の電子添文の記載に基づき作成した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

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－

（2020年4月改訂）

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（https://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を利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．

目　　次

Ⅰ．概要に関する項目

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

Ⅱ．名称に関する項目

1．販売名 …… 3
2．一般名 …… 3
3．構造式又は示性式 …… 3
4．分子式及び分子量 …… 3
5．化学名（命名法）又は本質 …… 4
6．慣用名，別名，略号，記号番号 …… 4

Ⅲ．有効成分に関する項目

1．物理化学的性質 …… 5
2．有効成分の各種条件下における安定性 …… 6
3．有効成分の確認試験法，定量法 …… 7

Ⅳ．製剤に関する項目

1．剤形 …… 8
2．製剤の組成 …… 9
3．添付溶解液の組成及び容量 …… 9
4．力価 …… 9
5．混入する可能性のある夾雑物 …… 9
6．製剤の各種条件下における安定性 …… 10
7．調製法及び溶解後の安定性 …… 11
8．他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 11
9．溶出性 …… 11
10．容器・包装 …… 13
11．別途提供される資材類 …… 14
12．その他 …… 14

Ⅴ．治療に関する項目

1．効能又は効果 …… 15
2．効能又は効果に関連する注意 …… 15
3．用法及び用量 …… 15
4．用法及び用量に関連する注意 …… 16
5．臨床成績 …… 16

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 …… 18
2．薬理作用 …… 18

Ⅶ．薬物動態に関する項目

1．血中濃度の推移 …… 19
2．薬物速度論的パラメータ …… 19
3．母集団（ポピュレーション）解析 …… 20
4．吸収 …… 20
5．分布 …… 20
6．代謝 …… 21
7．排泄 …… 22
8．トランスポーターに関する情報 …… 22
9．透析等による除去率 …… 22
10．特定の背景を有する患者 …… 22
11．その他 …… 23

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 …… 24
2．禁忌内容とその理由 …… 24
3．効能又は効果に関連する注意とその理由 …… 24
4．用法及び用量に関連する注意とその理由 …… 24
5．重要な基本的注意とその理由 …… 24
6．特定の背景を有する患者に関する注意 …… 24
7．相互作用 …… 25
8．副作用 …… 25
9．臨床検査結果に及ぼす影響 …… 25
10．過量投与 …… 25
11．適用上の注意 …… 26
12．その他の注意 …… 26

Ⅸ．非臨床試験に関する項目

1．薬理試験 …… 27
2．毒性試験 …… 27

Ⅹ．管理的事項に関する項目

1．規制区分 …… 29
2．有効期間 …… 29

3. 包装状態での貯法 ····· 29
4. 取扱い上の注意 ····· 29
5. 患者向け資材 ····· 29
6. 同一成分・同効薬 ····· 29
7. 国際誕生年月日 ····· 29
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 ····· 29
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 ····· 30
10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 ····· 30
11. 再審査期間 ····· 30
12. 投薬期間制限に関する情報 ····· 30
13. 各種コード ····· 30
14. 保険給付上の注意 ····· 30

ＸⅠ．文献

1. 引用文献 ····· 31
2. その他の参考文献 ····· 31

ＸⅡ．参考資料

1. 主な外国での発売状況 ····· 32
2. 海外における臨床支援情報 ····· 32

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 ····· 33
2. その他の関連資料 ····· 33

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

麻薬性鎮咳剤は強力な鎮咳作用を有するが、反面、呼吸抑制や便秘等の副作用や習慣性、耽溺性の点より、非麻薬性の合成鎮咳剤が各種検討されてきた。

東京大学薬学部・高木教授らは、鎮咳薬の生物試験法を確立し、鎮痙剤、交感神経興奮剤、抗ヒスタミン剤などについて、系統的に鎮咳効果を観察したところ、ジフェンヒドラミンにかなり強い鎮咳効果のあることを見出し、その同族化合物のうち、クロペラスチン塩酸塩が最も強力な鎮咳作用を有し、かつ毒性はジフェンヒドラミンの 1/2 であることを見出した。

これらの知見に基づき種々検討の結果、本品の臨床効果や安全性が確認された。

1965 年 5 月に糖衣錠、散が承認を受け 1966 年に販売を開始した。その後、錠小児用は 1970 年 3 月に承認を受け、1972 年 4 月に販売を開始し、シロップは 1972 年 7 月に承認を受け、1972 年 12 月に販売を開始した。

糖衣錠、散、錠小児用については、1976 年 10 月 28 日に医薬品再評価結果その 10 にて「有用性が認められるもの」との再評価結果通知を受けた。

また、2002 年 3 月（散）、2009 年 6 月（錠小児用）及び 2009 年 7 月（糖衣錠、シロップ）に販売名変更に伴う再承認を受け、2002 年 7 月（散）及び 2009 年 9 月（錠小児用、糖衣錠、シロップ）に変更銘柄名で薬価収載された。

2017 年 10 月にニプロ ES ファーマ株式会社が田辺三菱製薬株式会社より移管を受け販売を開始した。同月 15 日にはニプロ ES ファーマ株式会社が田辺三菱製薬株式会社より製造販売承認を承継した。

なお、フスタゾールシロップ 0.2%は 2014 年 11 月に販売を中止した（経過措置期間満了日：2015 年 3 月 31 日）。

2025 年 4 月 にニプロ株式会社がニプロESファーマ株式会社より製造販売承認を承継した。

２．製品の治療学的特性

○求心路並びに遠心路には作用せず、咳中枢に直接作用し、鎮咳作用を示す。また動物においては、気管支筋弛緩作用及び抗ヒスタミン作用も認められている。[4)、5)]

○臨床的には、感冒、急性気管支炎、慢性気管支炎、気管支拡張症、肺結核及び肺癌に伴う咳嗽に有用性が認められている。

３．製品の製剤学的特性

○成人及び小児に対して投与可能な糖衣錠、散剤の他に小児用の錠剤がある。

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	タイトル・参照先
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

該当しない

（２）流通・使用上の制限事項

該当しない

６．ＲＭＰの概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

１．販売名

（１）和　　名：フスタゾール糖衣錠 10mg
　　フスタゾール散 10％
　　フスタゾール錠小児用 2.5mg

（２）洋　　名：HUSTAZOL SUGAR-COATED Tablets
　　HUSTAZOL Powder
　　HUSTAZOL Tablets for Children

（３）名称の由来：咳=Husten（独語）から

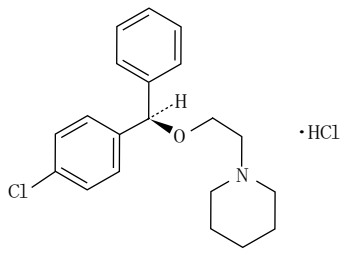
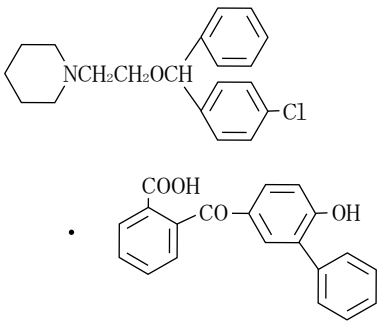
２．一般名

（１）和　名（命名法）：＜糖衣錠＞
　　クロペラスチン塩酸塩（JAN）
　　＜散・錠小児用＞
　　クロペラスチンフェンジゾ酸塩（JAN）

（２）洋　名（命名法）：＜糖衣錠＞
　　Cloperastine Hydrochloride（JAN）
　　＜散・錠小児用＞
　　Cloperastine Fendizoate（JAN）

（３）ステム（stem）：

３．構造式又は示性式

糖衣錠	散・錠小児用
 及び鏡像異性体	

４．分子式及び分子量

糖衣錠	散・錠小児用
分子式：$C_{20}H_{24}ClNO \cdot HCl$ 分子量：366.32	分子式：$C_{20}H_{24}ClNO \cdot C_{20}H_{14}O_4$ 分子量：648.20

５．化学名（命名法）又は本質

糖衣錠	散・錠小児用
1-{2-[(*RS*)-(4-Chlorophenyl)(phenyl)methoxy]ethyl}piperidine monohydrochloride	1-〔2-(*p*-Chloro-*α*-phenylbenzyloxy)ethyl〕piperidine 2-〔(6-hydroxy-(1,1'-biphenyl)-3-yl)carbonyl〕 benzoate

６．慣用名，別名，略号，記号番号

該当資料なし

Ⅲ．有効成分に関する項目

１．物理化学的性質

（１）外観・性状

クロペラスチン塩酸塩	クロペラスチンフェンジゾ酸塩
白色の結晶又は結晶性の粉末である。無臭又は僅かに特異なにおいがあり、味は苦い[13]。	白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

（２）溶解性

クロペラスチン塩酸塩	クロペラスチンフェンジゾ酸塩
水、メタノール、エタノール（95）又は酢酸（100）に極めて溶けやすく、無水酢酸にやや溶けやすい。 溶解度（37℃） pH1.2：100mg/mL 以上 pH4.0：100mg/mL 以上 pH6.8：100mg/mL 以上 水：100mg/mL 以上	イソプロピルアミンに溶けやすく、酢酸(100)に溶けにくく、水、メタノール、エタノール（95）又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。 溶解度（37℃） pH1.2：6.253mg/mL pH4.0：0.007mg/mL pH6.8：0.009mg/mL 水：0.007mg/mL

（３）吸湿性

該当資料なし

（４）融点（分解点），沸点，凝固点

クロペラスチン塩酸塩	クロペラスチンフェンジゾ酸塩
融点：148～152℃	融点：185～189℃

（５）酸塩基解離定数

クロペラスチン塩酸塩	クロペラスチンフェンジゾ酸塩
pKa=9.5（ピペリジン環、滴定法）	pKa=8.4（ピペリジン環、滴定法）

（６）分配係数

該当資料なし

（７）その他の主な示性値

クロペラスチン塩酸塩	クロペラスチンフェンジゾ酸塩
水溶液（1→10）は旋光性を示さない。	該当資料なし

2．有効成分の各種条件下における安定性

(1)クロペラスチン塩酸塩

試験の種類	保存条件		保存形態	保存期間	結果
長期保存試験*1	25℃、60%RH		ポリエチレン袋（二重）＋ミニファイバードラム	2年	変化なし
加速試験*1	40℃、75%RH		ポリエチレン袋（二重）＋ミニファイバードラム	6ヵ月	変化なし
苛酷試験*2	温度・湿度	60℃、75%RH	—	4ヵ月	約30%の分解がみられた
	光	白色蛍光灯（1,000lx）	—	60万lx・h	変化なし

＊1.試験項目：性状、確認試験、融点、純度試験、強熱残分、乾燥減量、含量

＊2.試験項目：性状、溶状、類縁物質（薄層クロマトグラフィー）、含量

＜酸・アルカリ水溶液中での安定性＞

(1)2%HCl中で4時間加熱環流した結果、分解物が認められた。1%NaOH中4時間加熱した結果では、分解物は認められなかった。

(2)pH1.2、pH4.0、pH6.8及び水において、遮光下・37℃で4時間まで安定である。

(3)pH1.2、pH4.0、pH6.8及び水において、室温・室内散乱光（約1,000lx）下、室温で4時間まで安定である。

(2)クロペラスチンフェンジゾ酸塩

試験の種類	保存条件		保存形態	保存期間	結果
長期保存試験*1	25℃、60%RH		ポリエチレン袋（二重）＋ミニファイバードラム	4年	変化なし
加速試験*1	40℃、75%RH		ポリエチレン袋（二重）＋ミニファイバードラム	6ヵ月	変化なし
苛酷試験	温度	60℃	—	4ヵ月	変化なし
	温度・湿度	60℃、75%RH	—	4ヵ月	変化なし

＊1.試験項目：性状、確認試験、融点、純度試験〔類縁物質〕、乾燥減量、含量

＜酸・アルカリ水溶液中での安定性＞

(1)pH1.2、pH4.0、pH6.8及び水において、遮光下・37℃で8時間まで安定である。

(2)pH1.2、pH4.0、pH6.8及び水において、室温・室内散乱光（約1,000lx）下、室温で24時間まで安定である。

３．有効成分の確認試験法，定量法

有効成分の確認試験法

クロペラスチン塩酸塩	クロペラスチンフェンジゾ酸塩
日局「クロペラスチン塩酸塩」の確認試験による。 (1)紫外可視吸光度測定法 (2)赤外吸収スペクトル測定法 （塩化カリウム錠剤法） (3)塩化物の定性反応	日局「クロペラスチンフェンジゾ酸塩」の確認試験による。 (1)紫外可視吸光度測定法 (2)赤外吸収スペクトル測定法 （臭化カリウム錠剤法）

有効成分の定量法

クロペラスチン塩酸塩	クロペラスチンフェンジゾ酸塩
日局「クロペラスチン塩酸塩」の定量法による。 電位差滴定法（0.1mol/L 過塩素酸）	日局「クロペラスチンフェンジゾ酸塩」の定量法による。 電位差滴定法（0.1mol/L 過塩素酸）

Ⅳ. 製剤に関する項目

１．剤形

（１）剤形の区別

（２）製剤の外観及び性状

フスタゾール糖衣錠 10mg

色・剤形	紅色・糖衣錠		
外形、 大きさ等			
	直径（mm） 6.7	厚さ（mm） 3.7	重量（mg） 120
識別コード	Y-HU10		

フスタゾール散 10%

色・剤形	白色の散剤

フスタゾール錠小児用 2.5mg

色・剤形	白色・直方体・錠剤・甘味を有し、崩壊しやすい		
外形、 大きさ等			
	径（mm） 6.0	厚さ（mm） 3.8	重量（mg） 180

（３）識別コード

糖衣錠：Y-HU10

（４）製剤の物性

（散） 粒度分布：18 号：全通、30 号残：5%以下

（５）その他

該当しない

２．製剤の組成

（１）有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

フスタゾール糖衣錠 10mg：

有効成分	1 錠中 日局クロペラスチン塩酸塩 10mg
添加剤	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、無水ケイ酸、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、白糖、酸化チタン、ステアリン酸、マクロゴール 6000、カルナウバロウ、赤色 3 号アルミニウムレーキ

フスタゾール散 10％：

有効成分	1g 中 日局クロペラスチンフェンジゾ酸塩　177mg （クロペラスチン塩酸塩として 100mg に相当）
添加剤	乳糖水和物、トウモロコシデンプン

フスタゾール錠小児用 2.5mg：

有効成分	1 錠中 日局クロペラスチンフェンジゾ酸塩　4.4mg （クロペラスチン塩酸塩として 2.5mg に相当）
添加剤	白糖、D-マンニトール、セルロース、トウモロコシデンプン、メチルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、タルク、プロピレングリコール、香料

（２）電解質等の濃度

該当しない

（３）熱量

該当しない

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

4-クロロベンゾフェノン

６．製剤の各種条件下における安定性

＜フスタゾール糖衣錠 10mg ＞

試験の種類	保存条件		保存形態	保存期間	結果
長期保存試験*1	25℃、60%RH		PTP 包装＋アルミニウムラミネート袋＋紙箱	5 年	変化なし
			ポリエチレン容器	5 年	変化なし
加速試験*2	40℃、75%RH		PTP 包装＋アルミニウムラミネート袋	6 ヵ月	変化なし
			着色ポリエチレン容器	6 ヵ月	変化なし
苛酷試験	温度	40℃*3	無色透明気密容器	3 ヵ月	変化なし
	湿度	40℃、75%RH*4	無色透明気密容器	3 ヵ月	変化なし
			無色透明容器（開放）	30 日	外観がわずかに退色し、硬度の低下が認められた。
	光	蛍光灯*3（1,000lx）	無色透明気密容器	30 日	変化なし

＊1. 試験項目：性状・確認試験・溶出性・含量
＊2. 試験項目：性状、確認試験、硬度、水分、崩壊試験、溶出試験、薄層クロマトグラフィー（TLC）、含量
＊3. 試験項目：外観、硬度、崩壊試験、薄層クロマトグラフィー（TLC）、含量
＊4. 試験項目：外観、硬度、崩壊試験、吸水率、薄層クロマトグラフィー（TLC）、含量

＜フスタゾール散 10%＞

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験*1	25℃、60%RH	アルミニウムラミネート袋＋紙箱	6 年	変化なし
加速試験*2	40℃、75%RH	アルミニウムラミネート袋＋紙箱	6 ヵ月	変化なし
		ポリエチレン袋＋紙箱	6 ヵ月	わずかな吸湿が認められた。

＊1. 試験項目：性状・確認試験・純度試験・溶出性・含量
＊2. 試験項目：性状、確認試験、水分、溶出試験、粒度、薄層クロマトグラフィー（TLC）、含量

＜フスタゾール錠小児用 2.5mg ＞

試験の種類	保存条件		保存形態	保存期間	結果
長期保存試験*1	25℃、60%RH		PTP ＋紙箱	5 年	変化なし
苛酷試験	温度	41.5℃	気密容器*2	7 ヵ月	変化なし
			—*3	—	崩壊時間が短くなったが、他の試験項目は変化なし。
	湿度*4	75%RH	—	4 日	賦形剤が吸湿性を有するが、1%以下の吸湿であった。
		82%RH	—	4 日	賦形剤の吸湿性により、5%前後の吸湿がみられた。

＊1. 試験項目：性状・確認試験・含量・溶出試験・質量・錠厚・錠径・硬度・崩壊時間
＊2. 試験項目：含量
＊3. 試験項目：外観、臭い、崩壊性、硬度
＊4. 試験項目：吸湿率

7．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

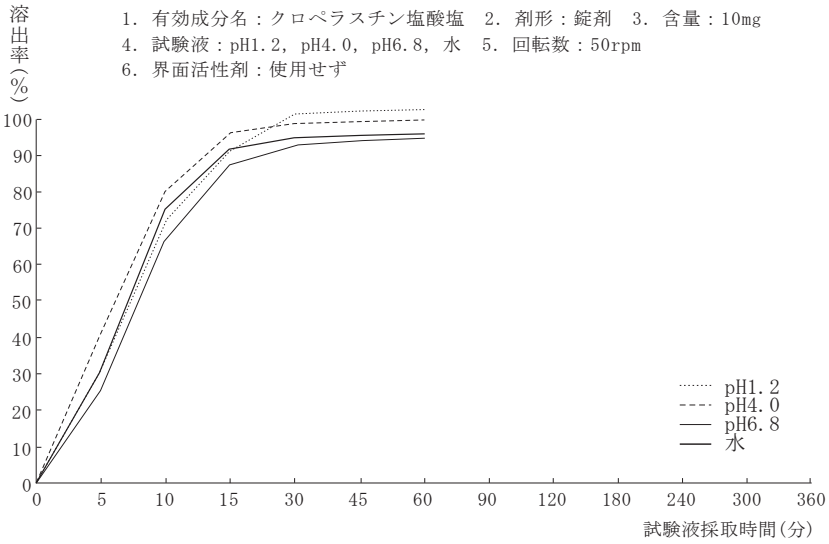
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

9．溶出性

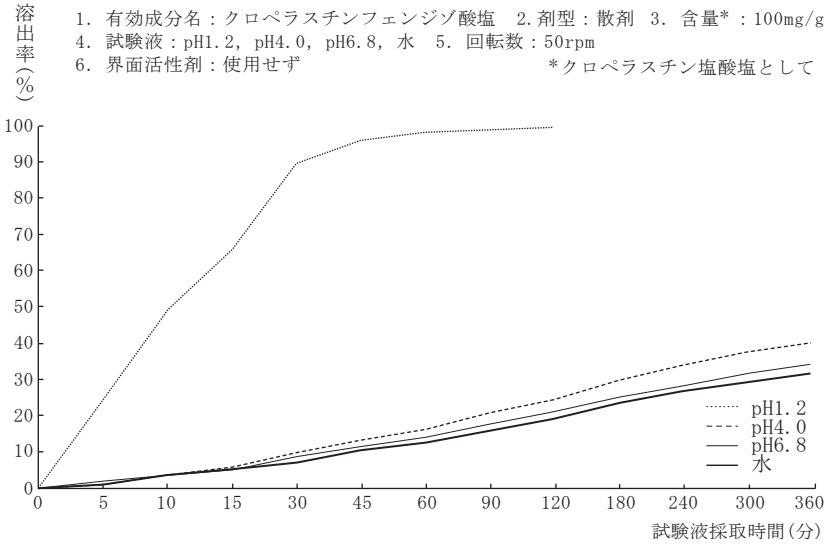
糖衣錠：「局外規」クロペラスチン塩酸塩錠の溶出試験による。すなわち、試験液に水 900mL を用い、「日局」溶出試験法のパドル法により毎分 50 回転で試験を行うとき、15 分間の溶出率は 85%以上である。

フスタゾール糖衣錠10mg



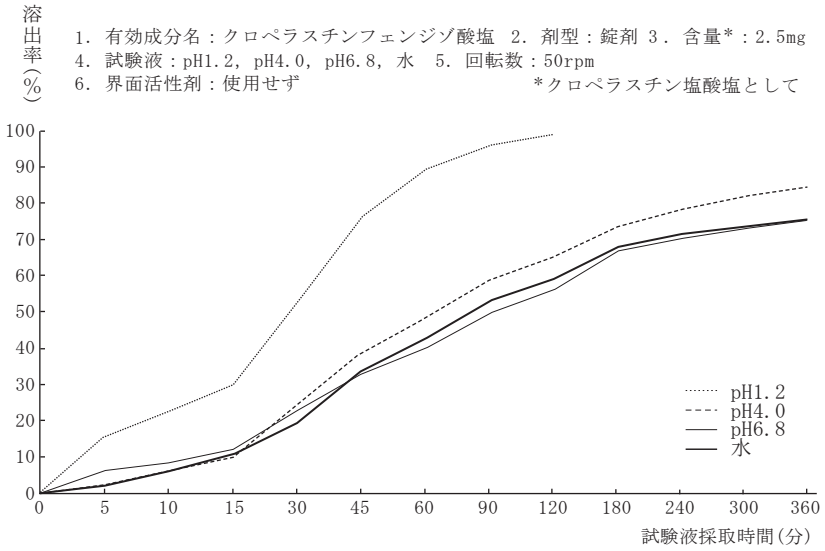
散：「局外規」クロペラスチンフェンジゾ酸塩散の溶出試験による。すなわち、試験液に崩壊試験法の第1液900mLを用い、「日局」溶出試験法のパドル法により毎分50回転で試験を行うとき、45分間の溶出率は70%以上である。

フスタゾール散10%



錠小児用：「局外規」クロペラスチンフェンジゾ酸塩錠の溶出試験による。すなわち、試験液に崩壊試験法の第1液900mLを用い、「日局」溶出試験法のパドル法により、毎分50回転で試験を行うとき、90分間の溶出率は75%以上である。

フスタゾール錠小児用2.5mg



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

該当しない

（２）包装

（糖衣錠）

22. 包装

100 錠[10 錠(PTP)×10]

1,000 錠[10 錠(PTP)×100]

1,000 錠[瓶、バラ、乾燥剤入り]

（散）

22. 包装

500g[アルミ袋]

（錠小児用）

22. 包装

500 錠[10 錠(PTP)×50]

（３）予備容量

該当しない

（４）容器の材質

（糖衣錠）

PTP 包装：PTP（ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔）
＋アルミニウム袋（アルミニウムラミネートフィルム）＋紙箱

バラ包装：ポリエチレン容器、ポリプロピレンキャップ

（散）

アルミニウムポリエチレンラミネート袋＋紙箱

（錠小児用）

PTP 包装：PTP（ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔）＋紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

Ⅴ．治療に関する項目

１．効能又は効果

（糖衣錠、散、錠小児用）共通

4. 効能又は効果

下記疾患に伴う咳嗽

感冒、急性気管支炎、慢性気管支炎、気管支拡張症、肺結核、肺癌

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

（糖衣錠）

6. 用法及び用量

クロペラスチン塩酸塩として、通常成人1日30～60mgを3回に分割経口投与する。
小児にはクロペラスチン塩酸塩として、1日2歳未満7.5mg、2歳以上4歳未満7.5～15mg、4歳以上7歳未満15～30mgを3回に分割経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

（散）

6. 用法及び用量

クロペラスチン塩酸塩として、通常成人1日30～60mg（クロペラスチンフェンジゾ酸塩として53.1～106.2mg）を3回に分割経口投与する。小児にはクロペラスチン塩酸塩として、1日2歳未満7.5mg、2歳以上4歳未満7.5～15mg、4歳以上7歳未満15～30mgを3回に分割経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

（錠小児用）

6. 用法及び用量

クロペラスチン塩酸塩として、1日2歳未満7.5mg、2歳以上4歳未満7.5～15mg、4歳以上7歳未満15～30mgを3回に分割経口投与する。
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

（散）

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 1日投与量

1日あたりの製剤量は以下のとおりである。

	散10%としての1日投与量
成人	300mg～600mg
小児　2歳未満	75mg
小児　2歳以上4歳未満	75～150mg
小児　4歳以上7歳未満	150～300mg

５．臨床成績

（１）臨床データパッケージ

該当資料なし

（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

（糖衣錠）

17.1.1 国内一般臨床試験

142例について実施された臨床試験の概要は次のとおりである。

疾患名	有効率
感冒	85.4%（35例/41例）
急性気管支炎	77.8%（14例/18例）
慢性気管支炎	66.7%（8例/12例）
気管支拡張症	66.7%（6例/9例）
肺結核	66.7%（34例/51例）
肺癌	72.7%（8例/11例）

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調査・試験の概要

該当資料なし

（７）その他

該当資料なし

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

デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物　等

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

（糖衣錠、散、錠小児用）共通

18.1 作用機序

求心路並びに遠心路には作用せず、咳中枢に直接作用するものと考えられている[4)]。

（２）薬効を裏付ける試験成績

（糖衣錠、散、錠小児用）共通

18.2 鎮咳作用

機械的刺激法による鎮咳作用は、モルモットではコデインリン酸塩水和物より強力であり[5)]、イヌではコデインリン酸塩水和物よりやや弱い。

18.3 気管支筋弛緩作用

モルモット摘出気管支筋を用いた実験で、パパベリンと同程度の気管支筋弛緩作用を示す[4)]。

18.4 抗ヒスタミン作用

モルモット摘出気管支筋を用いた実験で、緩和な抗ヒスタミン作用を示す[4)]。

（３）作用発現時間・持続時間

該当資料なし

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

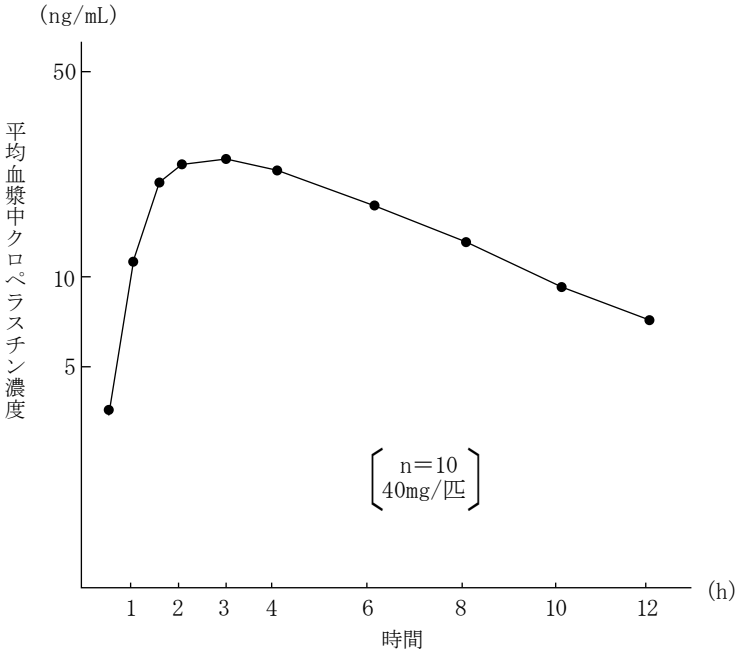
（2）臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

＜参考＞動物でのデータ

(糖衣錠)

イヌにクロペラスチン塩酸塩 40mg を経口投与した場合、投与後 1.5～4 時間で最高血中濃度に達し、最高血中濃度は、12～58ng/mL である。また、血中濃度曲線下面積（AUC）は 68.8～333.8ng・h/mL である。



（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

該当資料なし

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

該当資料なし

＜参考＞動物でのデータ

クロペラスチン塩酸塩は、吸収が極めて良く、ほとんど小腸で吸収される。

（投与後 4 時間で約 85%が吸収される。）

また、クロペラスチンフェンジゾ酸塩は、塩酸塩よりも吸収はやや遅く、そのシロップ剤は投与後 6 時間で約 90%が吸収される。（ラット）

５．分布

（１）血液－脳関門通過性

該当資料なし

＜参考＞動物でのデータ

クロペラスチンフェンジゾ酸塩をラットに経口投与した場合、脳への分布が認められた[6)]。

〔「(5) その他の組織への移行性」の項参照。〕

（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

該当資料なし

＜参考＞動物でのデータ

クロペラスチンフェンジゾ酸塩をラットに経口投与した場合、肝臓への分布が最も多く、次いで腎、肺に多く分布する。各組織内濃度は投与2時間後最高値を示し、24時間後にはほとんど認められない[6)]。（ラット）

^{14}C-Cloperastine syrup 経口投与後の生体内分布

Tissues	Time in hours				
	1/2	2	6	24	72
Brain	0.012	0.039	0.036	0.030	0.008
Lung	0.089	0.213	0.175	0.028	0.018
Thymus	0.013	0.046	0.042	0.015	0.010
Heart	0.018	0.039	0.039	0.016	0.006
Liver	0.800	1.110	0.875	0.215	0.094
Spleen	0.015	0.062	0.050	0.030	0.008
Adrenal	0.044	0.139	0.101	0.024	0.010
Kidney	0.092	0.267	0.333	0.091	0.034
Fat	0.013	0.074	0.050	0.009	0.002
Muscle	0.012	0.026	0.026	0.007	0.003
Blood	0.021	0.049	0.039	0.007	0.004
Serum	0.024	0.058	0.053	0.009	0.001

% of dose/g of tissue
Each value was obtained from 3 rats

（６）血漿蛋白結合率

該当資料なし

６．代謝

（１）代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

＜参考＞動物でのデータ

胆汁中代謝物について検討した結果、未変化体はきわめて少なく、代謝物の1つはpiperidine及びethylene側鎖は変化なくphenyl基が水酸化されグルクロン酸抱合を受けたものと推定された〔ラット、10mg/kg（クロペラスチン塩酸塩として)、経口〕[6)]。

（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

(1)排泄部位及び経路

該当資料なし

＜参考＞動物でのデータ

主排泄経路は胆汁中で、3 日以内に尿及び糞中にそれぞれ 26%、64%が排泄され、その大部分は 24 時間以内に排泄される。また塩の相違による尿中並びに糞中排泄率に差は認められていない〔ラット、10mg/kg（クロペラスチン塩酸塩として）、経口、腹腔内投与〕[6)]。

(2)排泄率

健常な成人男子にフスタゾール糖衣錠 10mg を 2 錠（クロペラスチン塩酸塩として 20mg）を投与した場合、48 時間までに投与量の約 33%が尿中に排泄された。

＜参考＞動物でのデータ

（散、錠小児用）

> **16.5 排泄**
>
> クロペラスチンフェンジゾ酸塩をラットに経口投与した場合、3 日以内に尿中に 25%、糞中に 70%が排泄される[6)]。

（糖衣錠）

> **16.5 排泄**
>
> クロペラスチン塩酸塩をラットに経口投与した場合、3 日以内に尿中に 26%、糞中に 64%が排泄される[6)]。

(3)排泄速度

健常な成人男子にフスタゾール糖衣錠 10mg を 2 錠（クロペラスチン塩酸塩として 20mg）投与した場合、尿中薬物排泄速度のピーク値は 0.5320±0.0216 （mg/h）で、ピーク到達時間は 6.20±0.359（h）であった。

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

該当資料なし

10．特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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

設定されていない

２．禁忌内容とその理由

設定されていない

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

「Ⅴ.4.用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

５．重要な基本的注意とその理由

設定されていない

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

設定されていない

（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

（糖衣錠、散）

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

（糖衣錠、散）

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

設定されていない

（８）高齢者

（糖衣錠、散）

> 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。

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

設定されていない

８．副作用

（糖衣錠、散、錠小児用）共通

> 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

設定されていない

（２）その他の副作用

（糖衣錠、散、錠小児用）共通

11.2 その他の副作用

	頻度不明
精神神経系	眠気
消化器	悪心、食欲不振、口渇

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

（糖衣錠、錠小児用）

> **14. 適用上の注意**
>
> **14.1 薬剤交付時の注意**
>
> 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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

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[5)]

1)血管に対する作用

アドレナリンによる収縮に対する抑制率及び抗バリウム作用はジフェンヒドラミンより強い（モルモット大動脈片及び肺動脈片）。

2)血圧、呼吸に対する作用

クロペラスチン塩酸塩 1mg/kg（静注）では約 50mmHg の下降が認められるが、呼吸には著変は認められない。

3)催眠時間延長作用

クロペラスチン塩酸塩はヘキソバルビタールナトリウムによる催眠作用を増強させる傾向があるが、単独投与（腹腔内注射）では催眠作用はみられない（ハツカネズミ）。

（3）その他の薬理試験

副次的薬理試験

該当資料なし

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

急性毒性

クロペラスチン塩酸塩[7)]

(LD_{50}*mg/kg)

投与経路＼使用動物	マウス	ラット
経口	600	2,325
腹腔内	96	120

クロペラスチンフェンジゾ酸塩[8)]

(LD_{50}*mg/kg)

投与経路＼使用動物	マウス		ラット	
	♂	♀	♂	♀
経口	>10,000 (>5,651)	>10,000 (>5,651)	>10,000 (>5,651)	>10,000 (>5,651)
腹腔内	2,288 (1,293)	2,558 (1,446)	3,701 (2,092)	3,840 (2,170)

（ ）内の数値は塩酸塩換算値

＊LD_{50}(median lethal dose)：50%致死量(試験動物の 50%を致死させる量)

（２）反復投与毒性試験 [7)]

慢性毒性

クロペラスチン塩酸塩をラットに 1 日 20、40、80、160mg/kg を 180 日間経口投与した結果、投与開始 1.5 ヵ月までは各群とも成長状態に差異はなかったが、それ以後、40、80、160mg/kg 投与群にわずかに抑制がみられた。しかし 20mg/kg 群は影響がなかった。

（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

クロペラスチン塩酸塩をマウスに妊娠 7 日目から 6 日間及びラットに妊娠 9 日目から 6 日間、1 日 12、60mg/kg を経口投与した結果、対照群に比し特に差は認められていない [9)、10)]。

クロペラスチンフェンジゾ酸塩をマウスに妊娠 7 日目から 12 日目まで、ラットに妊娠 9 日目から 14 日目まで 1 日 100、250、500mg/kg を 6 日間経口投与した実験で、対照群に比し特に差は認められていない [11)]。

（６）局所刺激性試験

該当資料なし

（７）その他の特殊毒性

1）身体依存性 [12)]

①ラットでクロペラスチン塩酸塩の反復投与を中断した時、あるいはレバロルファンの交代投与を行ったとき、モルヒネ投与の際に見られる身体依存の結果としての動作異常や特異症状の発現及び 24 時間後の一過性の体重の減少は認められない。

②モルヒネ反復投与ラットの投与中断 24 時間後に見られる体重減少は、クロペラスチン塩酸塩の交代投与によって防止できない。

又、交代投与時に動作異常や特異な症状を発現しない。

よってクロペラスチン塩酸塩にはモルヒネに対する代償性及びレバロルファン様の拮抗性は共に認められない。

以上により、クロペラスチン塩酸塩には身体依存性はないものと考えられる。

X．管理的事項に関する項目

1．規制区分

製　　剤：該当しない

有効成分：該当しない

2．有効期間

5年

3．包装状態での貯法

室温保存

4．取扱い上の注意

該当しない

5．患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり　　：あり

その他患者向け資材：なし

6．同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同　効　薬：デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物　等

7．国際誕生年月日

1965年5月10日

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	：	（糖衣錠）	2009年7月1日（販売名変更に伴う再承認）
		（散）	2002年3月11日（販売名変更に伴う再承認）
		（錠小児用）	2009年6月26日（販売名変更に伴う再承認）
承認番号	：	（糖衣錠）	22100AMX01672000
		（散）	21400AMZ00241000
		（錠小児用）	22100AMX01395000
薬価基準収載年月日	：	（糖衣錠）	2009年9月25日（変更銘柄名での収載日）
		（散）	2002年7月5日（変更銘柄名での収載日）
		（錠小児用）	2009年9月25日（変更銘柄名での収載日）

販売開始年月日　　:（糖衣錠）　1966 年 1 月 21 日
（散）　1966 年 1 月 21 日
（錠小児用）　1972 年 4 月 17 日

[注1]2017 年 10 月 に田辺製薬販売株式会社（現 ニプロESファーマ株式会社）が田辺三菱製薬株式会社より製造販売承認を承継

[注2]2025 年 4 月 にニプロ株式会社がニプロESファーマ株式会社より製造販売承認を承継

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

該当しない

10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果通知年月日：1976 年 10 月 28 日

内容：「有用性が認められるもの」と判定された

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

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード（YJ コード）	HOT（9 桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
フスタゾール糖衣錠 10mg	2229004F1030	2229004F1030	103782104	620378201
フスタゾール散 10%	2229006B1038	2229006B1038	103784504	610463170
フスタゾール錠小児用 2.5mg	2229006F1030	2229006F1030	103785204	620378501

14. 保険給付上の注意

該当しない

ＸⅠ．文献

１．引用文献

1)佐藤晃：薬物療法 1970；**3**（2）：319-320

2)都通彦　他：新薬と臨床 1967；**16**（7）：819-821

3)高木昭三　他：臨床小児医学 1966；**14**（5）：335-336

4)高木敬次郎　他：薬学雑誌 1967；**87**（8）：907-914

5)高木敬次郎　他：薬学雑誌 1961；**81**（2）：261-265

6)加藤安之　他：応用薬理 1971；**5**（5）：735-739

7)クロペラスチン塩酸塩の非臨床試験に関わる資料１（社内資料）

8)クロペラスチンフェンジゾ酸塩の非臨床試験に関わる資料１（社内資料）

9)クロペラスチン塩酸塩の非臨床試験に関わる資料２（社内資料）

10)クロペラスチン塩酸塩の非臨床試験に関わる資料３（社内資料）

11)クロペラスチンフェンジゾ酸塩の非臨床試験に関わる資料２（社内資料）

12)クロペラスチン塩酸塩の非臨床試験に関わる資料４（社内資料）

13)第十八改正日本薬局方解説書、廣川書店 2021；C-1772～C-1775

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

該当資料なし

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

本項の情報に関する注意

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

（掲載根拠：「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するQ&Aについて（その3）」令和元年9月6日付 厚生労働省医薬・生活衛生局 監視指導・麻薬対策課 事務連絡）

（1）粉砕

該当資料なし

（2）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし