

貯法：室温保存
有効期間：3年

承認番号	販売開始
22100AMX01135000	1999年7月

アレルギー性鼻炎治療剤
ケトチフェンフマル酸塩点鼻液
ケトチフェン点鼻液0.05% [CH]
Ketotifen Nasal Solution

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ケトチフェン点鼻液0.05% [CH]
有効成分	1容器 (8mL) 中 日局 ケトチフェンフマル酸塩 6.048mg (ケトチフェンとして4.398mg)
添加剤	グリセリン、ポリビニルアルコール (部分けん化物)、 濃ベンザルコニウム塩化物液50、水酸化ナトリウム

3.2 製剤の性状

販売名	ケトチフェン点鼻液0.05% [CH]
色調・剤形	無色～微黄色澄明の液
pH	3.8～4.6

4. 効能又は効果

アレルギー性鼻炎

6. 用法及び用量

通常、1日4回 (朝、昼、夕方及び就寝前)、1回各鼻腔に1噴霧 (ケトチフェンとして0.05mg) ずつ、鼻用定量噴霧器を用いて噴霧吸入する。

8. 重要な基本的注意

8.1 眠気を催すことがあるので、本剤使用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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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使用すること。

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。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

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の適切な処置を行うこと。

11.2 その他の副作用

	0.1%～5%未満	0.1%未満
鼻腔	鼻乾燥感、鼻刺激感	—
精神神経系	眠気、脱力感	頭痛

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

本剤に添付された「鼻用定量噴霧器の使い方」にしたがって正しく噴霧吸入するよう患者を指導すること。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

抗アレルギー作用及び抗ヒスタミン作用を有し、鼻汁中の好酸球数を減少させ、鼻粘膜の過敏性を減弱させる¹⁾。

18.2 抗アレルギー作用

ケトチフェンはPCA (受動的皮膚アナフィラキシー) 反応を抑制する (ラット)²⁾。

ヒスタミン、SRS-A等ケミカルメディエーターの遊離を抑制する (ラット腹腔肥満細胞、ヒト白血球中好塩基球・好中球*in vitro*)^{2) -4)}。

また、抗原及びPAF (血小板活性化因子) による好酸球の活性化を抑制する (モルモット⁵⁾、ヒビ⁶⁾)。

18.3 抗ヒスタミン作用

ケトチフェンはヒスタミンによる気管支収縮 (モルモット)、血管透過性亢進、皮膚反応 (ラット) 等を抑制する²⁾。

18.4 動物鼻炎モデルにおける作用

抗原誘発により生じる鼻粘膜組織中のSRS-A含量はケトチフェン前投与により減少する (モルモット、点鼻)⁷⁾。

18.5 誘発試験による鼻粘膜反応の抑制

アレルギー性鼻炎患者において、ケトチフェンは抗原により誘発される鼻粘膜反応を抑制する (点鼻)⁸⁾。また、ヒスタミンによる鼻粘膜反応を抑制し、鼻粘膜の過敏性を減弱させる (点鼻)¹⁾。

18.6 生物学的同等性試験

ラット及びモルモットを用いた実験的アレルギー性鼻炎モデルに対するケトチフェン点鼻液0.05% [CH] とザジテン点鼻液0.05%の生物学的同等性を検討した。

その結果、いずれのモデルにおいてもケトチフェン点鼻液0.05% [CH] 及びザジテン点鼻液0.05%は、無投与対照群と比較してアレルギー性鼻炎に対する有意な抑制作用を示し、また、両者間での抑制作用に有意差はみられず、生物学的同等性が確認された⁹⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ケトチフェンフマル酸塩 (Ketotifen Fumarate)

化学名：4-(1-Methylpiperidin-4-ylidene)-4H-benzo[4,5]cyclohepta[1,2-b]thiophen-10(9H)-one monofumarate

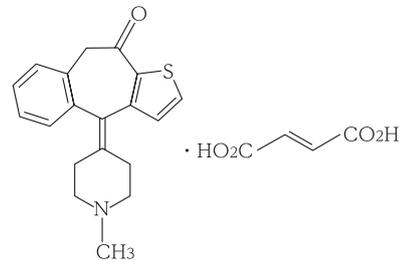
分子式：C₁₉H₁₉NOS · C₄H₄O₄

分子量：425.50

性状：白色～淡黄白色の結晶性の粉末である。

メタノール又は酢酸 (100) にやや溶けにくく、水、エタノール (99.5) 又は無水酢酸に溶けにくい。

構造式：



融点：約190℃ (分解)

22. 包装

ポリエチレン製容器 8mL×10本

23. 主要文献

- 1) 今野昭義ほか：耳鼻と臨床, 1990, 36 (2), 252-257
- 2) Martin, U. et al.: *Arzneim. -Forsch. Drug Res.*, 1978, 28 (5), 770-782
- 3) 熊谷 朗ほか：*メディカルサンド*, 1980, 8 (2), 87-93
- 4) 岸本真知子ほか：*アレルギーの臨床*, 1984, 4 (2), 149-151

- 5) Morley, J. et al. : Agents. Actions. Suppl., 1988, 23 (S) , 187-194
- 6) Arnoux, B. et al. : Am. Rev. Respir. Dis., 1988, 137 (4) , 855-860
- 7) 今野昭義ほか：耳鼻咽喉科臨床, 1989, 82 (6) , 879-886
- 8) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望, 1989, 32 (S5) , 395-406
- 9) 社内資料：生物学的の同等性試験

*** 24. 文献請求先及び問い合わせ先**

日本ジェネリック株式会社 お客様相談室
〒108-0014 東京都港区芝五丁目33番11号
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

 **Chosei 長生堂製薬株式会社**
徳島市国府町府中92番地

*** 26.2 販売元**

 **日本ジェネリック株式会社**
東京都港区芝五丁目33番11号