＊2026年11月改訂（第2版）
2023年10月改訂

貯　　法：室温保存
有効期間：3年

日本標準商品分類番号
871319

抗アレルギー点眼剤

ケトチフェンフマル酸塩点眼液

ケトチフェン点眼液0.05%「杏林」

KETOTIFEN Ophthalmic Solution

承認番号	22900AMX00595000
販売開始	2010年4月

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

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分 （1ml中）	ケトチフェンとして0.50mg （日局ケトチフェンフマル酸塩0.69mg）
添加剤	濃グリセリン、タウリン、ベンザルコニウム塩化物、pH調節剤

3.2 製剤の性状

性状	無色～微黄色澄明、無菌水性点眼剤
pH	4.8～5.8
浸透圧比	0.7～1.0（生理食塩液に対する比）
識別コード	PH006

4. 効能又は効果

アレルギー性結膜炎

6. 用法及び用量

通常1回1～2滴を1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。

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投与すること。

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。

11.2 その他の副作用

	0.1%～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	眼瞼炎、眼瞼皮膚炎、そう痒感	—	発疹、眼部腫脹、眼瞼浮腫、顔面浮腫
眼	結膜充血、刺激感	角膜びらん	眼痛、霧視、眼乾燥、結膜炎、羞明
その他	眠気	—	頭痛、口渇

注）発現頻度は使用成績調査を含む。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- 薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
- 患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
- 他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。
- ベンザルコニウム塩化物によりソフトコンタクトレンズを変色させることがあるので、ソフトコンタクトレンズを装用している場合は、点眼前にレンズを外し、点眼15分以上経過後に再装用すること[1]。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

^{14}C-ケトチフェンフマル酸塩の点眼液（9.67mg/0.195mCi/ml）50μlをウサギに1回投与したとき、血中への移行がみられたが低値であった。頻回投与した場合の定常状態における血漿中ケトチフェンフマル酸塩濃度は、結膜中の濃度の1/70程度と予測された[2]。

16.3 分布

^{14}C-ケトチフェンフマル酸塩の点眼液（9.67mg/0.195mCi/ml）50μlをウサギに1回投与し、眼組織への移行性を検討した。
眼組織における^{14}C-ケトチフェンフマル酸塩の濃度は投与後15分に最高値を示した。最も高い濃度を示したのは角膜（上皮）で、次いで結膜、角膜（内皮及び実質）、虹彩、強膜（前部）、毛様体、外眼筋、前房水の順であった。
他の眼組織中の平均滞留時間が3時間以下であるのに比べ、結膜では平均滞留時間が5.7時間と長い値を示した[2]。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内第Ⅲ相試験

アレルギー性結膜炎患者（262例）を対象にケトチフェン点眼液（128例）又はクロモグリク酸ナトリウム点眼液（134例）を1回1～2滴、1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）、4週間点眼した二重盲検比較試験において、全般改善度はケトチフェン点眼液群66%、クロモグリク酸ナトリウム点眼液群63%で両群間に有意差は認められなかった。またケトチフェン点眼液投与群に副作用は認められなかった[3]。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ケトチフェンフマル酸塩は、肥満細胞からのメディエーター遊離を抑制し、ヒスタミンH1受容体への結合を遮断することで抗アレルギー作用及び抗ヒスタミン作用を示す[4)、5)]。

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）[4]。
ヒスタミン、SRS-A等の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*）[4)、6)、7)]。
また、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、ヒヒ）[8)、9)]。

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[4]。

18.4 動物結膜炎モデルにおける作用

動物結膜炎モデルにおいてケトチフェンはIgE結膜炎（ラット、モルモット、点眼）及びCompound48/80誘発結膜炎を抑制する（ラット、点眼）[10]。
抗原誘発により結膜炎症状とともに好酸球、好中球の結膜浸潤がみられるが、ケトチフェンはこれを抑制する（モルモット、点眼）[11]。

18.5 生物学的同等性試験

18.5.1 実験的アレルギー性結膜炎に対する効果

ラット及びモルモットを用いた実験的アレルギー性結膜炎に対する効果として、抗原惹起による結膜部位の色素漏出の抑制率を比較した。ケトチフェン点眼液0.05%「杏林」、ザジテン点眼液0.05%、及び対照群として点眼液基剤の投与（点眼）による色素濃度について、Tukeyの多重比較検定を行った結果、ケトチフェン点眼液0.05%「杏林」及びザジテン点眼液0.05%の平均抑制率は対照群と比較して有意な高値を示し、また両製剤間において有意な差は認められなかったことより、生物学的な同等性が確認された[12]。

表18-1　色素漏出抑制率（%）

投与薬剤	ラット	モルモット
ケトチフェン点眼液0.05%「杏林」基剤	1.1±4.2	0.9±9.5
ケトチフェン点眼液0.05%「杏林」	64.8±6.9	50.3±5.1
ザジテン点眼液0.05%	61.1±3.3	46.6±5.9

（結膜PCA反応を用いたIgE結膜炎モデル、平均値±標準誤差、n=10）

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：ケトチフェンフマル酸塩（Ketotifen Fumarate）

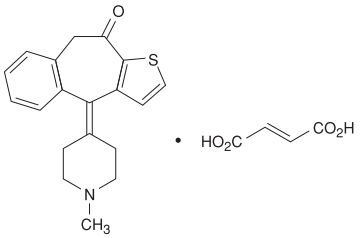
化学名：4-(1-Methylpiperidin-4-ylidene)-4*H*-benzo[4,5]cyclohepta[1,2-*b*]thiophen-10(9*H*)-one monofumarate

分子式：$C_{19}H_{19}NOS \cdot C_4H_4O_4$

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。
融点：約190℃（分解）

化学構造式：



22. 包装

プラスチック点眼容器　5mL×10本

23. 主要文献

1) Christensen, MT. et al.：CLAO J.1998; 24(4): 227-231
2) 太田真一ほか：臨床医薬. 1988; 4(11): 2183-2191
3) 三国郁夫ほか：臨床評価. 1989; 17(2): 275-297
4) Martin, U. et al.：Arzneim. -Forsch. 1978; 28(5): 770-782
5) 橋本敬太郎ほか：グッドマン・ギルマン薬理書 第13版. 廣川書店. 2022：1168-1175
6) 熊谷朗ほか：メディカルサンド. 1980; 8(2): 87-93
7) 岸本真知子ほか：アレルギーの臨床.1984; 4(2):149-151
8) Morley, J. et al.：Agents. Actions. Suppl. 1988; 23: 187-194
9) Arnoux, B. et al.：Am. Rev. Respir. Dis. 1988; 137(4): 855-860
10) 山口武ほか：医薬品研究. 1989; 20(1): 48-56
11) 石崎道治：アレルギー. 1986; 35(12): 1149-1157
12) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ケトチフェン点眼液0.05%「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料

*24. 文献請求先及び問い合わせ先

共創未来ファーマ株式会社　お客様相談室
〒104-0028　東京都中央区八重洲2-2-1
東京ミッドタウン八重洲　八重洲セントラルタワー 8F
TEL　050-3383-3846

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

キョーリンリメディオ株式会社
富山県南砺市井波885番地

26.2 販売元

共創未来ファーマ株式会社
東京都品川区広町1-4-4