

## 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 2013 に準拠して作成

アレルギー性疾患治療剤

# ケトチフェンシロップ0.02%「杏林」

KETOTIFEN Syrup 0.02% "KYORIN"

(ケトチフェンフマル酸塩シロップ)

剤形	シロップ剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL 中、ケトチフェンとして 0.2mg (日局ケトチフェンフマル酸塩 0.276mg) 含有
一般名	和名：ケトチフェンフマル酸塩(JAN) 洋名：Ketotifen Fumarate(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2017年6月29日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2017年12月8日（販売名変更による） 発売年月日：1992年7月10日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリンリメディオ株式会社 学術部 TEL：0120-960189 FAX：0120-189099 受付時間：9時～17時（土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.kyorin-rmd.co.jp/">http://www.kyorin-rmd.co.jp/</a>

本 IF は 2017 年 9 月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

# I F 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、I F と略す）の位置付け並びに I F 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において I F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな I F 記載要領 2008 が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-I F）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-I F が提供されることとなった。

最新版の e-I F は、(独) 医薬品医療機器総合機構のホームページ (<http://www.pmda.go.jp/>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-I F を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-I F の情報を検討する組織を設置して、個々の I F が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F 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 I F は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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。

### 【I F の様式】

- ①規格は A 4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② I F 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「I F 利用の手引きの概要」の全文を記載するも

のとし、2頁にまとめる。

### 【I Fの作成】

- ① I Fは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② I Fに記載する項目及び配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとのI Fの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「I F記載要領 2013」と略す）により作成されたI Fは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

### 【I Fの発行】

- ① 「I F記載要領 2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「I F記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはI Fが改訂される。

## 3. I Fの利用にあたって

「I F記載要領 2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のI Fについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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」に従って作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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薬剤師等自らが内容を充実させ、I F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、I Fが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり、その取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

I Fを薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。I Fは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、I Fがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

# 目 次

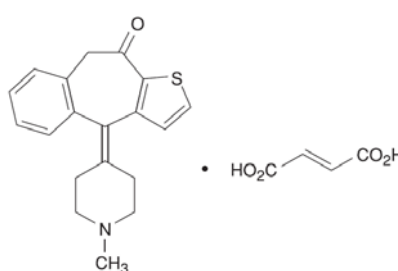
I. 概要に関する項目	1	VII. 薬物動態に関する項目	11
1. 開発の経緯	1	1. 血中濃度の推移・測定法	11
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 薬物速度論的パラメータ	12
II. 名称に関する項目	2	3. 吸収	12
1. 販売名	2	4. 分布	12
2. 一般名	2	5. 代謝	13
3. 構造式又は示性式	2	6. 排泄	13
4. 分子式及び分子量	2	7. トランスポーターに関する情報	13
5. 化学名(命名法)	2	8. 透析等による除去率	13
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	14
7. CAS登録番号	2	1. 警告内容とその理由	14
III. 有効成分に関する項目	3	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	14
1. 物理化学的性質	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	14
3. 有効成分の確認試験法	3	5. 慎重投与内容とその理由	14
4. 有効成分の定量法	3	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	14
IV. 製剤に関する項目	4	7. 相互作用	14
1. 剤形	4	8. 副作用	15
2. 製剤の組成	4	9. 高齢者への投与	16
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	16
4. 製剤の各種条件下における安定性	4	11. 小児等への投与	16
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	13. 過量投与	16
7. 溶出性	6	14. 適用上の注意	17
8. 生物学的試験法	6	15. その他の注意	17
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	6	16. その他	17
10. 製剤中の有効成分の定量法	6	IX. 非臨床試験に関する項目	18
11. 力価	6	1. 薬理試験	18
12. 混入する可能性のある夾雑物	6	2. 毒性試験	18
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6	X. 管理的事項に関する項目	19
14. その他	7	1. 規制区分	19
V. 治療に関する項目	8	2. 有効期間又は使用期限	19
1. 効能又は効果	8	3. 貯法・保存条件	19
2. 用法及び用量	8	4. 薬剤取扱い上の注意点	19
3. 臨床成績	8	5. 承認条件等	19
VI. 薬効薬理に関する項目	10	6. 包装	19
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10	7. 容器の材質	19
2. 薬理作用	10	8. 同一成分・同効薬	19
		9. 国際誕生年月日	19
		10. 製造販売承認年月日及び承認番号	20
		11. 薬価基準収載年月日	20

12. 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.....	20
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 .....	20
14. 再審査期間 .....	20
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報.....	20
16. 各種コード.....	20
17. 保険給付上の注意 .....	20
<b>XI. 文献</b> .....	<b>21</b>
1. 引用文献 .....	21
2. その他の参考文献.....	21
<b>XII. 参考資料</b> .....	<b>22</b>
1. 主な外国での発売状況.....	22
2. 海外における臨床支援情報 .....	22
<b>XIII. 備考</b> .....	<b>23</b>
1. その他の関連資料.....	23

# I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯	本剤は、後発医薬品として薬食発第 698 号(昭和 55 年 5 月 30 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を行い承認申請し、1992 年 2 月に承認を取得、1992 年 7 月に「セキトンシロップ」として発売に至った。その後、2007 年 6 月に「セキトンシロップ 0.02%」に名称変更し、2017 年 12 月に「ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」」に名称変更した。
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1) 抗原抗体反応に伴って起こる肥満細胞からのヒスタミンやロイコトリエン C4・D4 などのケミカルメディエーターの遊離を抑制すると共に、これらの作用に拮抗することにより、アレルギー症状を緩和する。 <sup>1)</sup> 2) 重大な副作用として、痙攣、興奮、肝機能障害、黄疸が報告されている。 (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。)

## II. 名称に関する項目

1. 販売名	
(1) 和名	ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」
(2) 洋名	KETOTIFEN Syrup 0.02% “KYORIN”
(3) 名称の由来	成分の一般名に由来する。
2. 一般名	
(1) 和名（命名法）	ケトチフェンフマル酸塩 (JAN)
(2) 洋名（命名法）	Ketotifen Fumarate (JAN) Ketotifen (INN)
(3) ステム	なし
3. 構造式又は示性式	
4. 分子式及び分子量	分子式：C <sub>19</sub> H <sub>19</sub> NOS · C <sub>4</sub> H <sub>4</sub> O <sub>4</sub> 分子量：425.50
5. 化学名（命名法）	4-(1-Methylpiperidin-4-ylidene)-4 <i>H</i> -benzo[4,5]cyclohepta[1,2- <i>b</i> ]thiophen-10(9 <i>H</i> )-one monofumarate (IUPAC)
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	特になし
7. CAS 登録番号	34580-14-8 (Ketotifen Fumarate) 34580-13-7 (Ketotifen)

### 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～淡黄白色の結晶性の粉末である。
(2) 溶解性	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。
(3) 吸湿性	該当資料なし
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点	融点：約 190℃（分解）
(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	該当資料なし
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	日本薬局方「ケトチフェンフマル酸塩」の確認試験による。 (1) 硫酸塩の定性反応 (2) 紫外可視吸光度測定法 (3) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
4. 有効成分の定量法	日本薬局方「ケトチフェンフマル酸塩」の定量法による。 電位差滴定法（0.1mol/L 過塩素酸で滴定）



## IV. 製剤に関する項目

<p>1. 剤形</p> <p>(1) 剤形の区別、外観及び性状</p>	<p>剤形：シロップ剤</p> <p>色調：無色～微黄色澄明</p>										
<p>(2) 製剤の物性</p>	<p>該当資料なし</p>										
<p>(3) 識別コード</p>	<p>該当しない</p>										
<p>(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等</p>	<p>pH：4.5～5.5</p>										
<p>2. 製剤の組成</p>											
<p>(1) 有効成分（活性成分）の含量</p>	<p>1mL 中、ケトチフェンとして 0.2mg （日局ケトチフェンフマル酸塩 0.276mg）含有</p>										
<p>(2) 添加物</p>	<p>D-ソルビトール、水アメ、白糖、クエン酸水和物、クエン酸ナトリウム水和物、メチルパラベン、プロピルパラベン、香料、プロピレングリコール</p>										
<p>(3) その他</p>	<p>特になし</p>										
<p>3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意</p>	<p>該当しない</p>										
<p>4. 製剤の各種条件下における安定性<sup>2),3)</sup></p>	<p><b>【長期保存試験】<sup>2)</sup></b></p> <p>&lt;保存条件&gt;</p> <p>25±2℃、60±5%RH</p> <p>&lt;試験検体&gt;</p> <p>ガラス製容器、ポリエチレン製穴栓及びポリプロピレン製キャップ、紙箱</p> <p>&lt;試験項目及び規格&gt;</p>										
	<table border="1"> <thead> <tr> <th>試験項目</th> <th>規格</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>性状</td> <td>無色～微黄色澄明の液で、芳香があり、味は甘い。</td> </tr> <tr> <td>pH</td> <td>4.5～5.5</td> </tr> <tr> <td>確認試験</td> <td>1) 呈色反応 2) 薄層クロマトグラフィー</td> </tr> <tr> <td>定量法</td> <td>含量：93.0～107.0%</td> </tr> </tbody> </table>	試験項目	規格	性状	無色～微黄色澄明の液で、芳香があり、味は甘い。	pH	4.5～5.5	確認試験	1) 呈色反応 2) 薄層クロマトグラフィー	定量法	含量：93.0～107.0%
試験項目	規格										
性状	無色～微黄色澄明の液で、芳香があり、味は甘い。										
pH	4.5～5.5										
確認試験	1) 呈色反応 2) 薄層クロマトグラフィー										
定量法	含量：93.0～107.0%										

## IV. 製剤に関する項目

< 試験結果 >

試験項目	開始時	0.5 年後	1 年後	2 年後	3 年後
性状	適	適	適	適	適
pH*	5.09	5.07	5.10	5.03	5.05
確認試験	適	適	適	適	適
定量(含量)**	100.4%	100.1%	99.5%	96.9%	95.2%

\*1 ロット n=1 の 3 ロットの平均値

\*\*1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

【加速試験】<sup>3)</sup>

< 保存条件 >

40±1℃、75±5%RH

< 試験検体 >

長期保存試験参照

< 試験項目及び規格 >

長期保存試験参照

< 試験結果 >

試験項目	開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状	適	適	適	適
pH*	5.04	5.04	5.00	4.97
確認試験	適	適	適	適
定量(含量)**	100.2%	99.4%	97.2%	94.0%

(1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値)

5. 調製法及び溶解後の  
安定性

該当しない

## IV. 製剤に関する項目

### 6. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

4)

ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」(18mL) と他剤の二者配合による外観及び pH 変化のみを記載したものです。配合による化学変化・効果の変化については観察されておりませんので、配合に際しては十分ご考慮下さい。

商品名	一般名	色調	容量 (mL)	pH	—は外観変化のないもの			
					配合直後		7日後	
					外観	pH	外観	pH
アストミンシロップ0.25%	ジメモルファンリン酸塩	橙色澄明	13	4.1	橙色	4.5	—	4.5
アスベリンシロップ0.5%	チベジンヒベンズ酸塩	白濁	14.4	4.8	白濁	4.9	—	4.9
塩酸アンブキシロール内用液 0.75%「PH」	アンブキシロール塩酸塩	無色澄明	4	5.6	無色	5.2	—	5.2
クロフェドリンS配合シロップ	ジヒドロゴディンリン酸塩、 d1-メチルエフェドリン塩酸塩、 クロルフェニラミンマレイン酸塩	黒色澄明	6	6.2	黒色	6.1	—	6.1
C-チステンシロップ5%	L-カルボシステイン	黄色澄明	18	5.4	黄色	5.1	—	5.1
フラビタンシロップ0.3%	フラビンアデニンジヌクレオチド	橙色澄明	9	5.1	黄色	5.1	—	5.1
ブリカニールシロップ 0.5mg/mL	テルブタリン硫酸塩	無色澄明	13.5	4.0	無色	4.4	—	4.4
ベネトリンシロップ0.04%	サルブタモール硫酸塩	無色澄明	22.5	3.6	無色	3.8	—	3.8
ボンタールシロップ3.25%	メフェナム酸	白濁	18	4.2	白濁	4.4	白濁 沈殿	4.5
メジコン配合シロップ	デキストロメトर्फファン臭化 水素酸塩水和物含有シロップ	淡黄褐色澄 明	14.4	3.8	淡黄褐 色	4.3	—	4.4
メブチンシロップ5μg/mL	プロカテロール塩酸塩水和物	無色澄明	12	3.9	無色	4.3	—	4.4

### 7. 溶出性

該当しない

### 8. 生物学的試験法

該当しない

### 9. 製剤中の有効成分の 確認試験法

- (1) 呈色反応
- (2) 薄層クロマトグラフィー

### 10. 製剤中の有効成分の 定量法

液体クロマトグラフィー

### 11. 力価

該当しない

### 12. 混入する可能性のあ る夾雑物

該当資料なし

### 13. 注意が必要な容器・ 外観が特殊な容器に 関する情報

特になし

## IV. 製剤に関する項目

---

14. その他

特になし

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	<p>気管支喘息 アレルギー性鼻炎 湿疹・皮膚炎、蕁麻疹、皮膚掻痒症</p>								
2. 用法及び用量	<p>通常、小児には1日量0.3mL/kg（ケトチフェンとして0.06mg/kg）を2回、朝食後及び就寝前に分けて経口投与する。 なお、年齢・症状により適宜増減する。 年齢別の標準投与量は、通常、下記の用量を1日量とし、1日2回、朝食後及び就寝前に分けて経口投与する。</p> <table border="1" data-bbox="488 750 1430 947"> <thead> <tr> <th>年齢</th> <th>1日用量</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>6ヵ月以上3才未満</td> <td>4mL（ケトチフェンとして0.8mg）</td> </tr> <tr> <td>3才以上7才未満</td> <td>6mL（ケトチフェンとして1.2mg）</td> </tr> <tr> <td>7才以上</td> <td>10mL（ケトチフェンとして2.0mg）</td> </tr> </tbody> </table> <p>ただし、1才未満の乳児に使用する場合には体重、症状などを考慮して適宜投与量を決めること。</p>	年齢	1日用量	6ヵ月以上3才未満	4mL（ケトチフェンとして0.8mg）	3才以上7才未満	6mL（ケトチフェンとして1.2mg）	7才以上	10mL（ケトチフェンとして2.0mg）
年齢	1日用量								
6ヵ月以上3才未満	4mL（ケトチフェンとして0.8mg）								
3才以上7才未満	6mL（ケトチフェンとして1.2mg）								
7才以上	10mL（ケトチフェンとして2.0mg）								
3. 臨床成績									
(1) 臨床データパッケージ	該当資料なし								
(2) 臨床効果	該当資料なし								
(3) 臨床薬理試験	該当資料なし								
(4) 探索的試験	該当資料なし								
(5) 検証的試験									
1) 無作為化並行用量反応試験	該当資料なし								
2) 比較試験	該当資料なし								
3) 安全性試験	該当資料なし								
4) 患者・病態別試験	該当資料なし								

## V. 治療に関する項目

---

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定  
使用成績調査（特別  
調査）・製造販売後  
臨床試験（市販後臨  
床試験）

該当資料なし

2) 承認条件として実  
施予定の内容又は  
実施した試験の概  
要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	第2世代ヒスタミンH <sub>1</sub> 受容体拮抗薬 アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、メキタジン、エメダスチンフマル酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、ロラタジン、レボセチリジン塩酸塩、レボカバスチン塩酸塩
2. 薬理作用	
(1) 作用部位・作用機序	ヒスタミンおよびSRS-A等のケミカルメディエーター遊離抑制に基づく抗アナフィラキシー作用、抗ヒスタミン作用および抗SRS-A作用を有し、また、気道および鼻粘膜等の組織の過敏性を減弱させる。さらにPAF(血小板活性化因子)による気道の反応性亢進を抑制する。
(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	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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

VII. 薬物動態に関する項目、1. 血中濃度の推移・測定法(3)臨床試験で確認された血中濃度の項を参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>5)</sup>

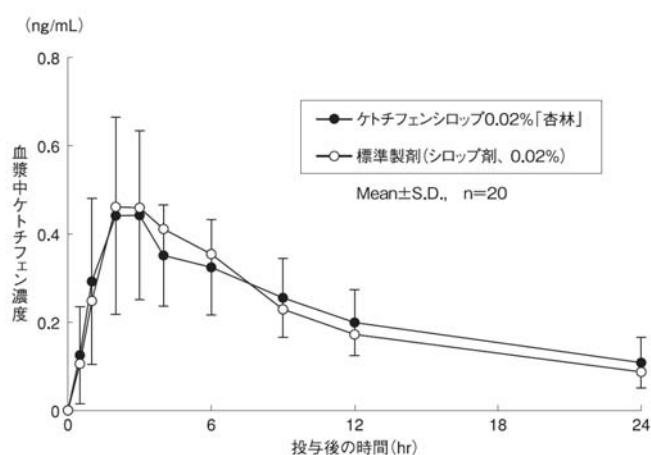
#### 【生物学的同等性試験】

生物学的同等性に関する試験基準(薬審第718号昭和55年5月30日)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

ケトチフェンシロップ0.02%「杏林」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ10mL(ケトチフェンとして2mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ	
	AUC <sub>0→24</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)
ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」	5.40±1.87	0.51±0.21
標準製剤 (シロップ剤、0.02%)	5.15±1.97	0.52±0.18

(Mean±S. D., n=20)



血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。



## VII. 薬物動態に関する項目

(4) 中毒域	該当資料なし
(5) 食事・併用薬の影響	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目、7. 相互作用の項を参照
(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因	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) バイオアベイラビリティ	該当資料なし
(4) 消失速度定数	該当資料なし
(5) クリアランス	該当資料なし
(6) 分布容積	該当資料なし
(7) 血漿蛋白結合率 <sup>1)</sup>	75%以上
3. 吸収	該当資料なし
4. 分布	
(1) 血液－脳関門通過性	該当資料なし
(2) 血液－胎盤関門通過性	該当資料なし
(3) 乳汁への移行性	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目、10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与(2)の項を参照

## VII. 薬物動態に関する項目

(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
5. 代謝	
(1) 代謝部位及び代謝経路 <sup>1)</sup>	主要代謝物はグルクロン酸抱合体で、その他 <i>N</i> -酸化体、脱メチル化体ができる。
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	該当資料なし
(3) 初回通過効果の有無及びその割合 <sup>1)</sup>	肝初回通過効果を受け、胆汁中に排泄されて、腸肝循環する。
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	該当資料なし
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	該当資料なし
6. 排泄	
(1) 排泄部位及び経路	該当資料なし
(2) 排泄率 <sup>1)</sup>	経口投与 (2mg、カプセル、シロップ) 後、120 時間までの尿中排泄率は 71%、ふん中排泄率はそれぞれ 26%である。
(3) 排泄速度	該当資料なし
7. トランスポーターに関する情報	該当資料なし
8. 透析等による除去率	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	該当しない
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	<div style="border: 1px solid red; padding: 5px;"> <p><b>【禁忌（次の患者には投与しないこと）】</b></p> <ol style="list-style-type: none"> <li>1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者</li> <li>2. てんかん又はその既往歴のある患者 [痙攣閾値を低下させることがある。]</li> </ol> </div>
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	該当しない
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	該当しない
5. 慎重投与内容とその理由	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p><b>慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）</b></p> <p>てんかんを除く痙攣性疾患、又はこれらの既往歴のある患者 [痙攣閾値を低下させることがある。]（【禁忌】の項参照）</p> </div>
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p><b>重要な基本的注意</b></p> <ol style="list-style-type: none"> <li>(1) 気管支喘息に用いる場合、本剤はすでに起こっている発作を速やかに軽減する薬剤ではないので、このことを患者に十分に説明しておく必要がある。</li> <li>(2) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量をはかる場合は十分な管理下で徐々に行うこと。</li> <li>(3) 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。</li> </ol> </div>
7. 相互作用	
(1) 併用禁忌とその理由	該当しない

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(2) 併用注意とその理由

### 【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 （鎮静剤、催眠剤等）	眠気、精神運動機能低下等を起こすことがある。	いずれも中枢神経抑制作用を有するため。
抗ヒスタミン剤	アルコール性飲料の摂取を制限すること。	
アルコール		

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

### 重大な副作用（頻度不明）

- 1) 痙攣、興奮：痙攣、興奮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し、適切な処置を行うこと（乳児、幼児では特に注意すること）。
- 2) 肝機能障害、黄疸：AST (GOT)、ALT (GPT)、A1-P、LDH、 $\gamma$ -GTPの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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し、適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

### その他の副作用

分類	副作用（頻度不明）
泌尿器 <sup>注)</sup>	頻尿、排尿痛、血尿、残尿感等の膀胱炎様症状
過敏症 <sup>注)</sup>	浮腫、多形紅斑、発疹、蕁麻疹
精神神経系	一過性の意識消失 <sup>注)</sup> 、頭痛、味覚異常、しびれ感、易刺激性、不眠、神経過敏、鎮静、眠気、めまい、ふらつき、けん怠感、口渇
消化器	腹痛、胃部不快感、食欲不振、口内炎、悪心、下痢、嘔吐、便秘
肝臓	LDH、 $\gamma$ -GTP、AST (GOT)、ALT (GPT)、A1-Pの上昇
その他	ほてり、鼻出血、動悸、月経異常、体重増加

注) このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	該当資料なし
(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度	該当資料なし
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	<p>(1) 禁忌（次の患者には投与しないこと） 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者</p> <p>(2) その他の副作用（頻度不明） 過敏症：浮腫、多形紅斑、発疹、蕁麻疹 このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。</p>
9. 高齢者への投与	該当資料なし
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	<p>(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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]</p> <p>(2) 授乳中の婦人には投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。[動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。]</p>
11. 小児等への投与	<p>乳児、幼児に投与する場合には、観察を十分に行い慎重に投与すること。[痙攣、興奮等の中樞神経症状があらわれることがある。]</p>
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	<p>本剤は、アレルギー皮膚内反応を抑制するため、アレルギー皮膚内反応検査を実施する3～5日前より本剤の投与を中止することが望ましい。</p>
13. 過量投与	<p><b>徴候、症状：</b>傾眠、見当識障害、チアノーゼ、呼吸困難、発熱、錯乱、痙攣、頻脈、徐脈、低血圧、眼振、可逆性昏睡等。特に小児では、興奮性亢進、痙攣。</p> <p><b>処置：</b>一般的な薬物除去法（催吐、胃洗浄、活性炭投与等）により、本剤を除去する。また必要に応じて対症療法を行う。</p>

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

---

14. 適用上の注意 該当しない

15. その他の注意 該当しない

16. その他 特になし

## 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」参照）	
(2) 副次的薬理試験	該当資料なし
(3) 安全性薬理試験	該当資料なし
(4) 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	該当資料なし
(2) 反復投与毒性試験	該当資料なし
(3) 生殖発生毒性試験	該当資料なし
(4) 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	ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」	該当しない
	有効成分	ケトチフェンフマル酸塩	該当しない
2. 有効期間又は使用期限	使用期限：3年（安定性試験結果に基づく <sup>2),3)</sup>		
3. 貯法・保存条件	室温保存		
4. 薬剤取扱い上の注意点			
(1) 薬局での取り扱い上の留意点について	特になし		
(2) 薬剤交付時の取り扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目、14. 適用上の注意の項を参照 くすりのしおり：有り		
(3) 調剤時の留意点について	特になし		
5. 承認条件等	該当しない		
6. 包装	500mL		
7. 容器の材質	褐色ガラス瓶、紙箱		
8. 同一成分・同効薬	同一成分薬：ザジテンシロップ 0.02% 同効薬：抗ヒスタミン作用を有する抗アレルギー薬（セチリジン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、アゼラスチン塩酸塩、メキタジン、エバスチン、ベポタスチンベシル酸塩、エメダスチンフマル酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩等）		
9. 国際誕生年月日	1987年10月		



## X. 管理的事項に関する項目

10. 製造販売承認年月日 及び承認番号	<p>製造販売承認年月日：2017年6月29日</p> <p>承認番号：</p> <p>（旧販売名）セキトンシロップ 製造販売承認年月日：1992年2月10日</p> <p>（旧販売名）セキトンシロップ0.02% 製造販売承認年月日：2007年2月2日</p>						
11. 薬価基準収載年月日	<p>2017年12月8日</p> <p>（旧販売名）セキトンシロップ 薬価基準収載年月日：1992年7月10日 経過措置期間終了：2008年3月31日</p> <p>（旧販売名）セキトンシロップ0.02% 薬価基準収載年月日：2007年6月15日 経過措置期間終了：2018年3月31日</p>						
12. 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						
13. 再審査結果、再評価 結果公表年月日及び その内容	該当しない						
14. 再審査期間	該当しない						
15. 投薬期間制限医薬品 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。						
16. 各種コード	<table border="1"> <thead> <tr> <th data-bbox="480 1635 799 1731">HOT(9桁)番号</th> <th data-bbox="799 1635 1118 1731">厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード</th> <th data-bbox="1118 1635 1436 1731">レセプト 電算コード</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="480 1731 799 1827">109454102</td> <td data-bbox="799 1731 1118 1827">4490003Q1010</td> <td data-bbox="1118 1731 1436 1827">620945402</td> </tr> </tbody> </table>	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード	109454102	4490003Q1010	620945402
HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード					
109454102	4490003Q1010	620945402					
17. 保険給付上の注意	本剤は診療報酬上の後発医薬品である。						

## XI. 文献

- |             |   |
|-------------|---|
| 1. 引用文献     | 1) 第十七改正日本薬局方解説書, C-1815 (廣川書店 2016)<br>2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：<br>ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」の安定性試験(長期保存試験)に関する資料<br>3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：<br>ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」の安定性試験(加速試験)に関する資料<br>4) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：<br>ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」の配合変化に関する資料<br>5) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：<br>ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料 |
| 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   | 該当しない  |
| 2. 海外における臨床支援情報 | 該当資料なし |

## XII. 備考

---

1. その他の関連資料

該当資料なし