

貯 法：室温保存
使用期限：外箱及びラベルに表示(期限内に使用すること。)

アレルギー性鼻炎治療剤

ケトチフェン点鼻液0.05%「杏林」

KETOTIFEN Nasal Solution 0.05% "KYORIN"

(ケトチフェン fumarate 点鼻液)

承認番号	22900AMX00596000
薬価収載	2017年12月
販売開始	1999年7月

【組成・性状】

成分・分量 (1容器8mL中)	ケトチフェンとして4.398mg (日局ケトチフェン fumarate 6.048mg)
添加物	濃グリセリン、ベンザルコニウム塩化物、 pH調節剤
剤形	水性点鼻液
性状	無色～微黄色澄明の液で、においはない か、又はわずかに特異なにおいがある。
pH	3.8～4.6
浸透圧比 ^注	約1

注(浸透圧比)：生理食塩液に対する比

【効能・効果】

アレルギー性鼻炎

【用法・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、噴霧吸入する。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

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。

2. 副作用

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。

その他の副作用

分類	副作用(頻度不明)
鼻腔	鼻乾燥感、鼻刺激感
精神神経系	眠気、脱力感、頭痛

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(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。]

(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。]

4. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

5. 適用上の注意

(1) 投与経路：鼻腔内噴霧用にのみ使用すること。

(2) 投与方法：本剤は専用の鼻用定量噴霧器を用いて噴霧吸入させること。

【薬効薬理】

1. 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、抗ヒスタミン作用及び抗SRS-A作用を有し、鼻汁中の好酸球を減少させ、鼻粘膜の過敏性を減弱させる。

2. 生物学的同源性試験¹⁾

(1) ラットの実験的アレルギー性鼻炎モデルにおいて、ケトチフェン点鼻液0.05%「杏林」、標準製剤、基剤投与群及び生理食塩液(陰性対照群)各0.5mLを鼻腔局所投与し、抗原誘発鼻粘膜血管透過性亢進に対する抑制作用を比較検討した。抑制効果の指標としては、抗原誘発5分後より流出する灌流液を10分間隔で2回採取し、色素漏出増加量を算出し検討を行った。その結果、本剤及び標準製剤の色素漏出増加量は、基剤投与群及び陰性対照群と比較して有意な低値を示し、また、両製剤間では有意差は認められず、生物学的な同源性が確認された。

(2) モルモットの実験的アレルギー性鼻炎モデルにおいて、本剤、標準製剤、基剤投与群及び生理食塩液(陰性対照群)各0.5mLを鼻腔局所投与し、抗原誘発鼻腔抵抗増加に対する抑制作用を比較検討した。抑制効果の指標としては、鼻腔内圧を測定して鼻腔抵抗を算出し、抗原誘発後の上昇率を比較した。その結果、本剤及び標準製剤の鼻腔抵抗上昇率は、基剤投与群及び陰性対照群と比較して有意な低値を示し、また、両製剤間では有意差は認められず、生物学的な同源性が確認された。

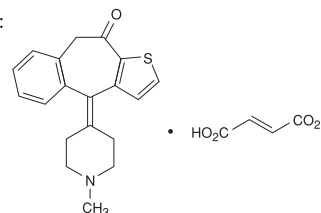
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ケトチフェン fumarate (Ketotifen Fumarate)

化学名：4-(1-Methylpiperidin-4-ylidene)-4H-benzo[4,5]

cyclohepta[1,2-b]thiophen-10(9H)-one monofumarate

構造式：

分子式：C₁₉H₁₉NOS · C₄H₄O₄

分子量：425.50

性状：ケトチフェン fumarate は白色～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)

【取扱い上の注意】

安定性試験²⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、3年間)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ケトチフェン点鼻液0.05%「杏林」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。

【包装】

8mL×10瓶

【主要文献】

- 1)キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
 ケトチフェン点鼻液0.05%「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料
- 2)キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
 ケトチフェン点鼻液0.05%「杏林」の安定性試験に関する資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料は下記にご請求下さい。

キョーリンリメディオ株式会社 学術部
〒920-0017 金沢市諸江町下丁287番地1
TEL 0120-960189
FAX 0120-189099

販売元
杏林製薬株式会社
東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地
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