

貯法：

室温保存

使用期限：

包装に表示の使用期限内
に使用すること

アレルギー性鼻炎治療剤

ザジテン®点鼻液0.05%

Zaditen® Nasal Solution 0.05%

ケトチフェンフマル酸塩点鼻液

| | |
|-------|------------------|
| 承認番号 | 22100AMX01748000 |
| 薬価収載 | 2009年9月 |
| 販売開始 | 1991年7月 |
| 再審査結果 | 1999年3月 |



【組成・性状】

| 品名 | ザジテン点鼻液0.05% |
|-------|--|
| 成分・含量 | 1容器（8mL）中ケトチフェンフマル酸塩（日局）6.048mg（ケトチフェンとして4.398mg） |
| 添加物 | ベンザルコニウム塩化物、クエン酸、D-ソルビトール、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、炭酸水素ナトリウム |
| 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おいがある。 |
| 製剤のpH | 3.8～4.6 |

【効能又は効果】

アレルギー性鼻炎

【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、本剤専用の鼻用定量噴霧器を用いて噴霧吸入する。

【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。

2. 副作用

総例6,681例中何らかの副作用が報告されたのは98例（1.5%）であった。主な副作用は眠気（1.0%）、鼻乾燥感（0.2%）、鼻刺激感（0.2%）等であった。

（再審査終了時までの集計）

| | 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 |

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への使用

- 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使用すること。〔妊娠中の使用に関する安全性は確立していない。〕
- 授乳中の婦人には使用することを避け、やむを得ず使用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. 小児等への使用

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

- 鼻腔内噴霧用により使用すること。
- 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。

【薬物動態】

1. 血中濃度

健康成人にザジテン点鼻液0.05%を鼻腔内にケトチフェンとして0.02mg、0.1mg及び0.2mg噴霧した後8時間にわたって血漿中濃度を測定した結果、血漿中濃度はいずれも検出限界以下であった。

2. 排泄

鼻腔内噴霧後8時間までの尿中排泄量は噴霧量の1～2%であったことから鼻腔内噴霧によりごくわずかであるが、循環血へ取り込まれることが示された。

【臨床成績】

比較試験を含むアレルギー性鼻炎における本剤の臨床試験成績の概要は次のとおりである。¹⁻⁴⁾

アレルギー性鼻炎に対する本剤の臨床効果判定は、鼻症状（くしゃみ、鼻汁、鼻閉）及び鼻粘膜所見等を調査して行った。

| 疾患名 | 有効率 |
|----------|----------------|
| アレルギー性鼻炎 | 60.1%（184/306） |

比較試験において本剤の有用性が確認された。

【薬効薬理】

薬理的には、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. 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）。⁵⁾

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*）。⁵⁻⁷⁾

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⁸⁾、ヒビ⁹⁾）。

2. 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。⁵⁾

3. 動物鼻炎モデルにおける作用

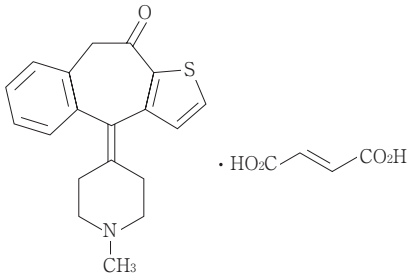
動物鼻炎モデルにおいてケトチフェンの投与により鼻汁分泌及び鼻汁中好酸球出現の抑制が認められている（モルモット）。抗原誘発により生じる鼻粘膜組織中のSRS-A含量はケトチフェン前投与により減少する（モルモット、点鼻）。¹⁰⁾

4. 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）。¹⁾ 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）。¹¹⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：ケトチフェン fumarate 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。

融点：約190℃(分解)

分配係数：0.7(1-オクタノール/0.1mol/L塩酸)

【包装】

ザジテン点鼻液0.05% 8 mL 10容器

【主要文献】

- 1) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望 32(S5), 395, 1989 [ZENJ00983]
- 2) 馬場駿吉ほか：耳鼻咽喉科展望 33(S1), 23, 1990 [ZENJ01082]
- 3) 黒野祐一ほか：耳鼻と臨床 35(5), 933, 1989 [ZENJ01002]
- 4) 佐川 充ほか：診療と新薬 26(6), 1033, 1989 [ZENJ00942]
- 5) Martin, U. et al. : *Arzneim.-Forsch. Drug Res.* 28(5), 770, 1978 [ZENM00019]
- 6) 熊谷 朗ほか：メディカルサント 8(2), 87, 1980 [ZENJ00016]
- 7) 岸本真知子ほか：アレルギーの臨床 4(2), 149, 1984 [ZENJ00110]
- 8) Morley, J. et al. : *Agents. Actions. Suppl.* 23, 187, 1988 [ZENM01112]
- 9) Arnoux, B. et al. : *Am. Rev. Respir. Dis.* 137(4), 855, 1988 [ZENM00894]
- 10) 今野昭義ほか：耳鼻咽喉科臨床 82(6), 879, 1989 [ZENJ00986]
- 11) 今野昭義ほか：耳鼻と臨床 36(2), 252, 1990 [ZENJ01112]

【文献請求先】

** 田辺三菱製薬株式会社 くすり相談センター
〒541-8505 大阪市中央区道修町3-2-10
電話 0120-753-280

(01)

** 製造販売
 サンファーマ株式会社
東京都港区芝公園1-7-6

** 販売
 田辺三菱製薬株式会社
大阪市中央区道修町3-2-10