

# 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

## アレルギー性鼻炎治療剤

# ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」

KETOTIFEN

ケトチフェンフマル酸塩点鼻液

剤形	点鼻剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	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)含有
一般名	和名:ケトチフェンフマル酸塩 洋名:Ketotifen Fumarate
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:2013年6月17日(販売名変更) 薬価基準収載年月日:2013年12月13日(販売名変更) 発売年月日:1998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:沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL:0120-381-999、FAX:06-6394-7355 医療関係者向けホームページ: <a href="http://med.sawai.co.jp">http://med.sawai.co.jp</a>

本IFは2014年10月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

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/>にてご確認ください。

# IF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、IFと略す)の位置付け並びにIF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IF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IF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IF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-IF)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-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.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-IF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-IFの情報を検討する組織を設置して、個々のIF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、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

## 2. IFとは

IF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IF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IF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。

### [IFの様式]

①規格はA4版、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。

- ②IF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「IF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。

#### [IFの作成]

- ①IF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。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIF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、「IF記載要領2013」と略す)により作成されたIF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。

#### [IFの発行]

- ①「IF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、「IF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IFが改訂される。

### 3. IFの利用にあたって

「IF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IF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、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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、IF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、IF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、IF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もあり、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

IF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。IF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、IF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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	16
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	16
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	16
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	16
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	16
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	16
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	17
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	17
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	17
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	17
3. 有効成分の確認試験法	4	14. 適用上の注意	18
4. 有効成分の定量法	5	15. その他の注意	18
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	18
1. 剤形	6	IX. 非臨床試験に関する項目	19
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	19
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	6	2. 毒性試験	19
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7	X. 管理的事項に関する項目	20
5. 製剤の各種条件下における安定性	7	1. 規制区分	20
6. 溶解後の安定性	7	2. 有効期間又は使用期限	20
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7	3. 貯法・保存条件	20
8. 溶出性	7	4. 薬剤取扱い上の注意点	20
9. 生物学的試験法	7	5. 承認条件等	20
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	7	6. 包装	20
11. 製剤中の有効成分の定量法	7	7. 容器の材質	20
12. 力価	8	8. 同一成分・同効薬	21
13. 混入する可能性のある夾雑物	8	9. 国際誕生年月日	21
14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	21
15. 刺激性	8	11. 薬価基準収載年月日	21
16. その他	8	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	21
V. 治療に関する項目	9	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
1. 効能又は効果	9	14. 再審査期間	21
2. 用法及び用量	9	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	21
3. 臨床成績	9	16. 各種コード	22
VI. 薬効薬理に関する項目	11	17. 保険給付上の注意	22
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	11	XI. 文献	23
2. 薬理作用	11	1. 引用文献	23
VII. 薬物動態に関する項目	13	2. その他の参考文献	23
1. 血中濃度の推移・測定法	13	XII. 参考資料	24
2. 薬物速度論的パラメータ	13	1. 主な外国での発売状況	24
3. 吸収	14	2. 海外における臨床支援情報	24
4. 分布	14	XIII. 備考	24
5. 代謝	14	その他の関連資料	24
6. 排泄	15		
7. トランスポーターに関する情報	15		
8. 透析等による除去率	15		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」は、日局ケトチフェンフマル酸塩を含有するアレルギー性鼻炎治療剤である。

ケトチフェンフマル酸塩は、肥満細胞や好塩基球・好中球からのヒスタミン、SRS-A等のケミカルメディエーター遊離抑制による抗アレルギー作用と特異的H<sub>1</sub>受容体拮抗による抗ヒスタミン作用を示す。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

	ケトテン点鼻液(旧販売名)
承認申請に際し準拠した通知名	昭和55年5月30日 薬発第698号
承認	1998年3月
上市	1998年7月

2008年12月に「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」(平成12年9月19日付 医薬発第935号)に基づき、「ケトテン点鼻液0.05%」に販売名を変更した。

また、2013年12月に「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づき、『ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」』に販売名を変更した。

なお、同一成分を含有する経口剤としてケトチフェンカプセル1mg/DS小児用0.1%「サワイ」を1994年に、点眼剤としてケトチフェン点眼液0.05%「SW」を1998年にそれぞれ上市している。

### 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C<sub>4</sub>・D<sub>4</sub>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) 副作用として、鼻乾燥感、鼻刺激感、眠気、脱力感等が報告されている(頻度不明)。

II. 名称に関する項目

---

II. 名称に関する項目

---

1. 販売名 .....

1) 和名

ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」

2) 洋名

KETOTIFEN

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

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)

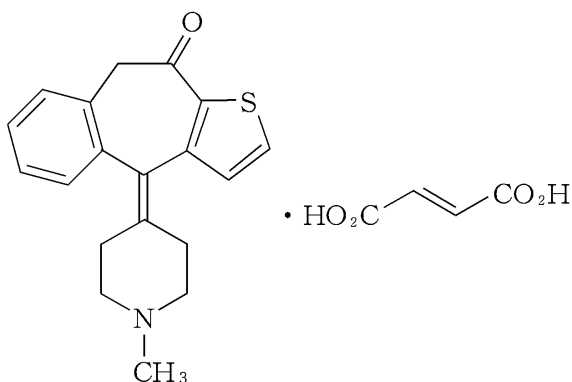
Ketotifen Fumarate(JAN)

Ketotifen(INN)

3) ステム

不明

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*H*-benzo[4,5]cyclohepta[1,2-*b*]thiophen-10(9*H*)-one monofumarate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....  
別名：フマル酸ケトチフェン

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。  
においはないか、わずかに特異なにおいがある。<sup>2)</sup>

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。

溶解度<sup>3)</sup> : pH1.2 : 45.5mg/mL、pH4.0 : 23.8mg/mL、pH6.8 : 21.3mg/mL、水 : 16.1 mg/mL

3) 吸湿性

乾燥減量 : 0.5%以下(1g、105℃、4時間)

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点 : 約190℃(分解)  
遊離ケトチフェンの融点は152～153℃である。<sup>1)</sup>

5) 酸塩基解離定数

pKa = 6.1<sup>3)</sup>

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

比吸光度  $E_{1\text{cm}}^{1\%}$  (296nm) : 320～350(メタノール)<sup>2)</sup>

pH : 3.4～3.8[水溶液(1→100)]<sup>2)</sup>

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

日局「ケトチフェンフマル酸塩」の確認試験に準ずる。

- 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



4. 有効成分の定量法 .....  
日局「ケトチフェンフマル酸塩」の定量法に準ずる。(電位差滴定法)

---

## IV. 製剤に関する項目

---

1. 剤形……………
  - 1) 投与経路  
点鼻
  - 2) 剤形の区別、外観及び性状  
区別：点鼻剤  
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。
  - 3) 製剤の物性  
該当資料なし
  - 4) 識別コード  
なし
  - 5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定なpH域等  
pH：3.8～4.6  
比重  $d_{20}$ ：約1.01
  - 6) 無菌の有無  
本剤は無菌製剤ではない。
2. 製剤の組成……………
  - 1) 有効成分(活性成分)の含量  
1 容器(8 mL)中に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)を含有する。
  - 2) 添加物  
添加物として、エデト酸Na、グリセリン、ベンザルコニウム塩化物、ポビドン、pH調節剤を含有する。
  - 3) 添付溶解液の組成及び容量  
該当しない
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法……………  
該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....  
 該当資料なし

5. 製剤の各種条件下における安定性 .....  
 ポリエチレン容器充てん品の安定性(長期保存試験)  
 ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」(ポリエチレン容器に充てんしたもの)について、安定性試験を行った。  
 その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。<sup>4)</sup>

保 存 条 件	イニシャル	室温・遮光 3年
性 状	無色～微黄色澄明の液であった	同左
pH	4.2	4.2
定 量 試 験 <sup>※</sup>	98.8	97.9

※：表示量に対する含有率(%)

6. 溶解後の安定性 .....  
 該当しない

7. 他剤との配合変化(物理化学的变化) .....  
 該当資料なし

8. 溶出性 .....  
 該当資料なし

9. 生物学的試験法 .....  
 該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....  
 1) ブロモフェノールブルー及びクロロホルムによる呈色反応  
 2) 2, 4-ジニトロフェニルヒドラジン試液による沈殿反応  
 3) 薄層クロマトグラフィー

11. 製剤中の有効成分の定量法 .....  
 液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

12. 力価 .....  
 該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物 .....  
 該当資料なし

14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....  
 該当資料なし

15. 刺激性 .....

**粘膜刺激性試験**

ウサギ(日本白色種、雄、2.72~2.90kg、1群6匹)に1回ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」50 $\mu$ L(ケトチフェンフマル酸塩として37.8 $\mu$ g)を右眼結膜嚢に点眼した。また、左眼結膜嚢にはコントロールとして生理食塩液を50 $\mu$ L点眼した。

投与は30分間隔で15回行い、投与終了1、3、24、48、72、96、168時間後にDraize法に基づき角膜、虹彩、結膜について判定・評価を行った。

その結果、ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」はウサギ眼粘膜に対して極めて弱い刺激性が観察されたが、評価基準では無刺激物の範囲内であり、回復性も良好であることから、臨床使用においても粘膜に対する刺激性が問題となることはないと考えられた。<sup>5)</sup>

**【ウサギへの頻回投与による眼粘膜刺激性試験結果】**

評価法	Draize法の平均刺激スコア							
	投与前	1時間	3時間	24時間	48時間	72時間	96時間	168時間
生理食塩液	0	0	0	0	0	0	0	0
ケトチフェン点鼻液 0.05%「サワイ」	0	0.7	0.7	0.7	0	0	0	0

16. その他.....  
 1本あたり噴霧可能回数：約84回

---

## V. 治療に関する項目

---

1. 効能又は効果……………  
アレルギー性鼻炎
  
2. 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、噴霧吸入する。
  
3. 臨床成績……………
  - 1) 臨床データパッケージ  
該当しない
  
  - 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
  
  - 6) 治療の使用
    - (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

V. 治療に関する項目

- (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

オキサトミド、エピナスチン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩等

### 2. 薬理作用

#### 1) 作用部位・作用機序

肥満細胞や好塩基球・好中球からのヒスタミン、SRS-A等のケミカルメディエーター遊離抑制による抗アレルギー作用と特異的H<sub>1</sub>受容体拮抗による抗ヒスタミン作用を示す。

#### 2) 薬効を裏付ける試験成績

##### <薬理的試験>

##### 1) モルモット鼻アレルギーモデルにおける抗アレルギー作用<sup>6)</sup>

###### <方法>

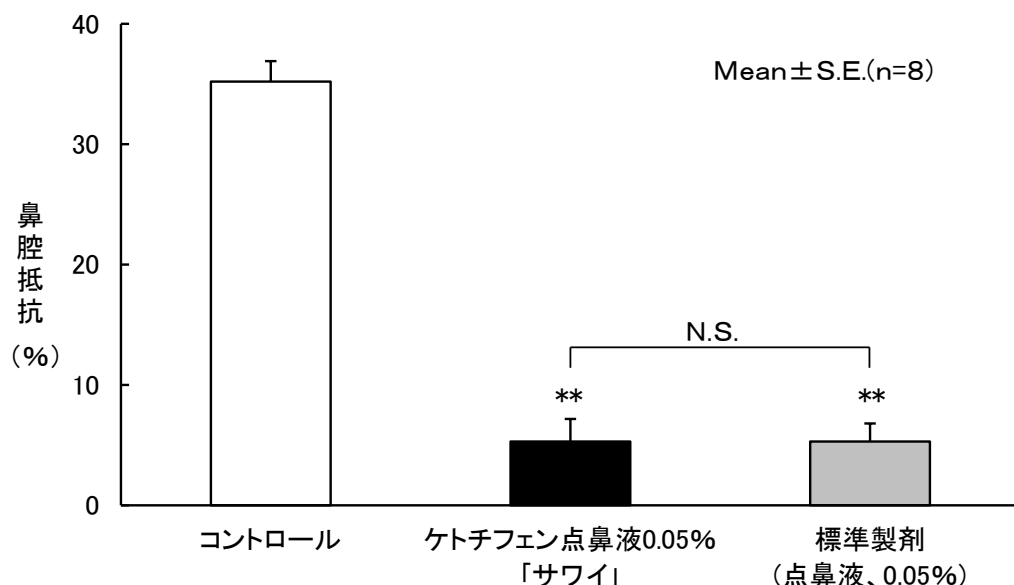
モルモット(Hartley系、雄性)に抗OA(Ovalbumin)モルモット血清を用いて感作させ、モルモット鼻アレルギーモデルを作製した。ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」、標準製剤及び注射用水(コントロール)を、抗原投与10分前及び5分前にそれぞれ左右の鼻腔内に各々2回(計4回)点鼻し、鼻腔抵抗の変化をbronchospirometryを用いて測定し、算出した。

結果は鼻腔を完全閉塞した時の送気圧を最大抵抗とし、最大反応時の鼻腔抵抗を百分率(%)で表した。

###### <結果>

ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」及び標準製剤投与群はコントロール群に対して鼻腔抵抗上昇の有意な抑制を示し、ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」投与群と標準製剤投与群には有意差を認めなかった。

以上の結果より、モルモット鼻アレルギーモデルにおいて両剤は同等の薬理効果を有する製剤であると判断した。



\*\* : p<0.01 vs コントロール  
(Tukey-Kramerによる多重比較検定)

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 2) ラット鼻灌流モデルにおける抗アレルギー作用<sup>6)</sup>

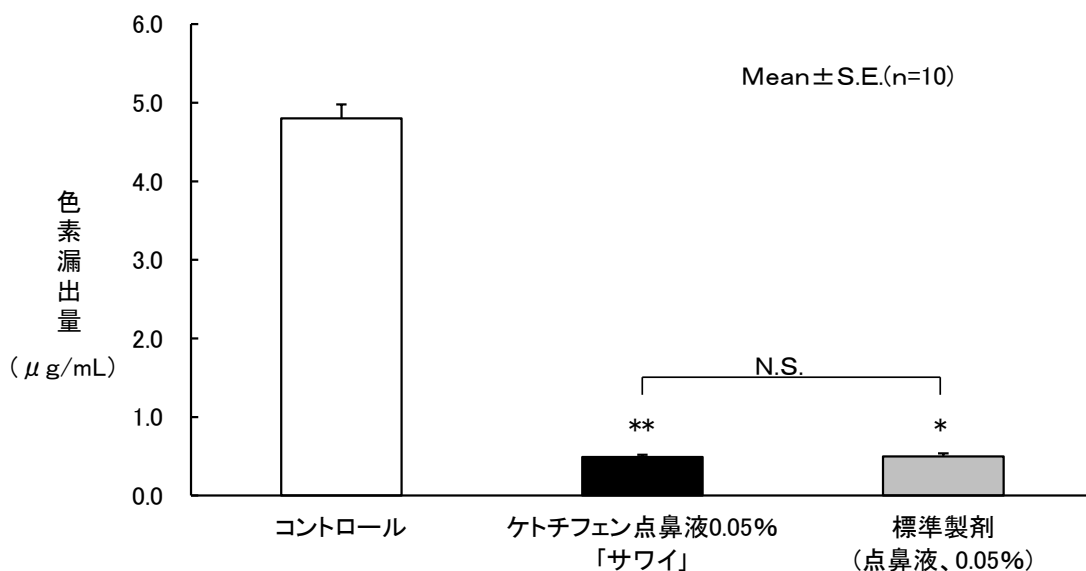
#### <方法>

ラット(Wistar系、雄性)に抗OA(Ovalbumin)ラット血清を用いて感作させ、ラット鼻灌流モデルを作製した。抗原投与15分前及び5分前にケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」、標準製剤及び注射用水(コントロール)をそれぞれ左右の鼻腔内に各200 $\mu$ L(ケトチフェンフマル酸塩として151.2 $\mu$ g)/kgずつ点鼻した。その後、色素(ポンタミンスカイブルー)を尾静注し、抗原を10分間、さらに生理食塩水のみを40分間灌流し、鼻吻より流出する灌流液中への色素漏出量を指標として抗アレルギー作用を検討した。

#### <結果>

ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」及び標準製剤投与群はコントロール群に対して色素漏出量の有意な抑制を示し、ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」投与群と標準製剤投与群には有意差を認めなかった。

以上の結果より、ラット鼻灌流モデルにおいて両剤は同等の薬理効果を有する製剤であると判断した。



\* :  $p < 0.05$ , \*\* :  $p < 0.01$  vs コントロール  
(Tukey-Kramerによる多重比較検定)

### 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

---

ケトチフェンフマル酸塩製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

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  
該当資料なし
  - 3) 臨床試験で確認された血中濃度  
該当資料なし
  - 4) 中毒域  
該当資料なし
  - 5) 食事・併用薬の影響  
該当資料なし
  - 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

VII. 薬物動態に関する項目

7) 血漿蛋白結合率

75%以上<sup>1)</sup>

3. 吸収 .....

吸収部位：鼻腔粘膜

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

<参考>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) 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

主要代謝物はグルクロン酸抱合体で、その他 *N*-酸化体、脱メチル化体ができる。<sup>1)</sup>

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

該当資料なし

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

該当資料なし

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)……………  
該当しない

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……………  
該当しない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法……………

**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。

7. 相互作用……………

1) 併用禁忌とその理由

該当しない

2) 併用注意とその理由

該当しない

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

該当しない

3) その他の副作用

	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

4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

ケトチフェンフマル酸塩製剤の副作用が以下のとおり報告されている。

副作用発現率は1.47%(98/6,681)であり、主な副作用は眠気1.02%、鼻刺激感0.24%、鼻の乾燥感0.19%、脱力(感)0.12%等であった。<sup>7)</sup>

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

該当資料なし

9. 高齢者への投与

該当しない

10. 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。]

11. 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)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

14. 適用上の注意 .....

- |   |
|---|
| <p>1) 鼻腔内噴霧用にのみ使用すること。<br/>2) 本剤に添付された携帯袋に記載の「鼻用定量噴霧器の使用法」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。</p> |
|---|

15. その他の注意 .....

該当しない

16. その他 .....

---

## IX. 非臨床試験に関する項目

---

ケトチフェンフマル酸塩の非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

### 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

LD<sub>50</sub> (mg/kg) <sup>2)</sup>

動物種	性	経口	皮下
マウス	♀	585	820
ラット	♀	360	480

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 .....

規制区分	
製剤	該当しない
有効成分	毒薬

2. 有効期間又は使用期限 .....

使用期限：3年

3. 貯法・保存条件 .....

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点 .....

1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

くすりのしおり：有り

Ⅷ. -6. 及びⅧ. -14. 参照

3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等 .....

該当しない

6. 包装 .....

10瓶

7. 容器の材質 .....

容器：ポリエチレン

ポンプ：ポリエチレン、ポリプロピレン

キャップ：ポリプロピレン



8. 同一成分・同効薬

同一成分：ケトチフェンカプセル1mg「サワイ」/DS小児用0.1%「サワイ」/点眼液0.05%「SW」  
ザジテン点鼻液0.05%/カプセル1mg/ドライシロップ0.1%/シロップ0.02%/点眼液0.05%/点眼液UD0.05%

同効薬：クロモグリク酸ナトリウム、レボカバスチン塩酸塩等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

●ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」

製造販売承認年月日：2013年6月17日(販売名変更)、承認番号：22500AMX00923000

ケトテン点鼻液0.05%(旧販売名)

製造販売承認年月日：2008年9月4日(販売名変更)、承認番号：22000AMX01891000

ケトテン点鼻液(旧販売名)

製造販売承認年月日：1998年3月12日、承認番号：21000AMZ00494000

11. 薬価基準収載年月日

●ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」：2013年12月13日(販売名変更)

ケトテン点鼻液0.05%(旧販売名)：2008年12月19日(販売名変更)

経過措置期間終了：2014年9月30日

ケトテン点鼻液(旧販売名)：1998年7月10日 経過措置期間終了：2009年8月31日

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。

X. 管理的事項に関する項目

16. 各種コード .....

HOT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
102317601	1329705Q1310	620231701

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) 日本薬局方解説書編集委員会編，第十六改正 日本薬局方解説書，廣川書店，2011，C-1606 - C-1609.
  - 2) 薬事研究会編，規制医薬品事典，第5版，じほう，1992，p.154.
  - 3) 日本公定書協会編，医療用医薬品 品質情報集，No.21，薬事日報社，2004，p.161.
  - 4) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]
  - 5) 沢井製薬(株) 社内資料[刺激性試験]
  - 6) 沢井製薬(株) 社内資料[薬理学的試験]
  - 7) 厚生省医薬安全局，平成10年度 新医薬品等の副作用のまとめ，2000，p.16.
2. その他の参考文献 .....

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....

2. 海外における臨床支援情報 .....

該当資料なし

---

## XIII. 備考

---

その他の関連資料 .....







