

貯法：室温保存
有効期間：3年日本標準商品分類番号
871329アレルギー性鼻炎治療剤
ケトチフェン fumarate 点鼻液ケトチフェン点鼻液 0.05%「サワイ」
KETOTIFEN Nasal Solution [SAWAI]承認番号 22500AMX00923000
販売開始 1998年7月

3. 組成・性状

3.1 組成

| | |
|----------------|---|
| 容量 | 1容器 8mL |
| 有効成分 [1容器中] | 日局ケトチフェン fumarate 6.048mg (ケトチフェンとして4.398mg) |
| 添加剤 | エデト酸Na、グリセリン、ベンザルコニウム塩化物、ポピドン、pH調節剤 |

3.2 製剤の性状

| | |
|----|-------------------------------------|
| 剤形 | 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 |
| pH | 3.8～4.6 |

4. 効能又は効果

アレルギー性鼻炎

6. 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。

8. 重要な基本的注意

8.1 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。

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使用すること。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

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の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 |
| 鼻腔 | 鼻乾燥感、鼻刺激感 | — |
| 精神神経系 | 眠気、脱力感 | 頭痛 |

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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方法」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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

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⁾。

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)²⁾。

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*)²⁾⁻⁴⁾。

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⁵⁾、ヒビ⁶⁾)。

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²⁾。

18.4 動物鼻炎モデルにおける作用

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)⁷⁾。

18.5 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)⁸⁾。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)¹⁾。

18.6 生物学的同源性試験

モルモット鼻アレルギーモデルにおける鼻粘膜抵抗およびラットアレルギー性鼻炎モデルにおける鼻粘膜からの色素漏出量を指標として、ケトチフェン点鼻液0.05%「サワイ」とザジテン点鼻液0.05%の抗アレルギー作用を比較検討した。その結果、両剤ともコントロール群に比して有意な抗アレルギー作用を示し、両剤間に有意な差は認められず、両剤は生物学的に同等であると判断された⁹⁾。

19. 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)-4*H*-benzo[4,5]

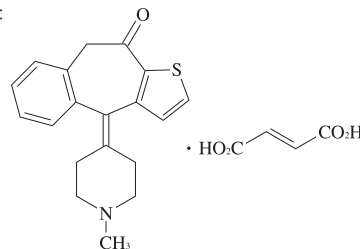
cyclohepta[1,2-*b*]thiophen-10(9*H*)-one monofumarate

分子式：C₁₉H₁₉NOS · C₄H₃O₄

分子量：425.50

融点：約190℃(分解)

構造式：



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。

22. 包装

プラスチック点鼻容器：8mL×10本

23. 主要文献

- 1) 今野昭義他：耳鼻と臨床, 1990; 36(2) : 252-257
- 2) Martin, U. et al : *Arzneim.-Forsch. Drug Res.*, 1978; 28(5) : 770-782
- 3) 熊谷明他：メディカルサント, 1980; 8(2) : 87-93
- 4) 岸本真知子他：アレルギーの臨床, 1984; 4(2) : 149-151
- 5) Morley, J. et al : *Agents Actions Suppl.*, 1988; 23 : 187-194
- 6) Arnoux, B. et al : *Am. Rev. Respir. Dis.*, 1988; 137(4) : 855-860
- 7) 今野昭義他：耳鼻咽喉科臨床, 1989; 82(6) : 879-886
- 8) 奥田稔他：耳鼻咽喉科展望, 1989; 32(S5) : 395-406
- 9) 社内資料：生物学的同源性試験

*24. 文献請求先及び問い合わせ先

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL : 0120-381-999 FAX : 06-7708-8966

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30