

貯法：室温保存  
有効期間：3年

## アレルギー性鼻炎治療剤

ケトチフェンフマル酸塩点鼻液

# ケトチフェン点鼻液0.05%「杏林」

KETOTIFEN Nasal Solution

承認番号	22900AMX00596000
販売開始	1999年7月

### 3. 組成・性状

#### 3.1 組成

有効成分	1容器(8mL)中ケトチフェンとして4.398mg (日局ケトチフェンフマル酸塩6.048mg)
添加剤	濃グリセリン、ベンザルコニウム塩化物、 pH調節剤

#### 3.2 製剤の性状

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

本剤に添付された患者用携帯袋に記載されている使用方法およ  
び注意事項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<sup>1)</sup>。

### 18.2 生物学的同等性試験

#### 18.2.1 抗原誘発鼻粘膜血管透過性亢進に対する抑制作用（ラット）

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」、ザジテン点鼻液0.05%、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、ケトチフェン点鼻液0.05%「杏林」及びザ  
ジテン点鼻液0.05%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、生物学的な同等性が確認された<sup>2)</sup>。

#### 18.2.2 抗原誘発鼻腔抵抗増加に対する抑制作用（モルモット）

モルモ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」、ザジテン点鼻液0.05%、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、ケトチフェン点鼻  
液0.05%「杏林」及びザジテン点鼻液0.05%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、生物学的な同等性が  
確認された<sup>2)</sup>。

### 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：ケトチフェンフマル酸塩 (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：C<sub>19</sub>H<sub>19</sub>NOS・C<sub>4</sub>H<sub>4</sub>O<sub>4</sub>

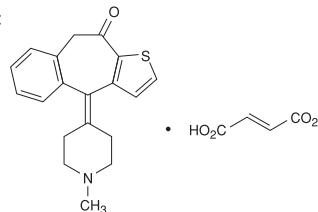
分子量：425.50

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）

化学構造式：



### 22. 包装

8mL×10

### 23. 主要文献

- 今野昭義ほか：耳鼻と臨床，1990，36（2），252-257
- 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

### 24. 文献請求先及び問い合わせ先

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

26. 製造販売業者等

26.1 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

\*26.2 販売元

**杏林製薬株式会社**

東京都千代田区大手町一丁目3番7号