

アレルギー性鼻炎治療剤

*ケトチフェン点鼻液0.05%「TOA」

*Ketotifen Nasal Solution 0.05%「TOA」

*ケトチフェンフマル酸塩点鼻液

* 承認番号	21900AMX01074000
* 薬価収載	2007年12月
販売開始	1998年 7月

貯 法：室温保存
使用期限：外箱等の表示を参照

【組成・性状】

販売名	ケトチフェン点鼻液0.05%「TOA」
成分・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)
添加物	グリセリン、ポビドン、濃ベンザルコニウム塩化物液50、エデト酸ナトリウム水和物、pH調整剤
性状	無色～微黄色澄明の液 においはないか、又はわずかに特異なにおい
pH	3.8～4.6
比重	d ₂₀ ²⁰ : 約1.01

【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に十分注意すること。

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ため、副作用発現頻度は不明である。

	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のみ使用すること。
[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) 鼻腔内噴霧用のみ使用すること。
- (2) 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。

【薬効薬理】

1. 薬理作用

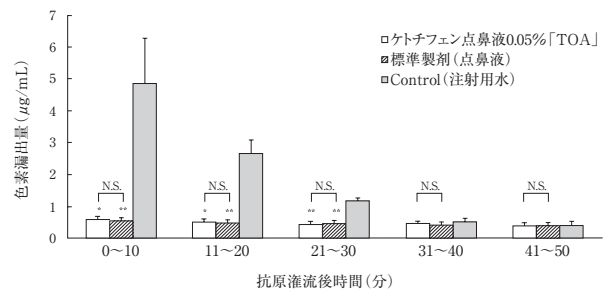
肥満細胞や好塩基球・好中球からのヒスタミン、SRS-A等のケミカルメディエーター遊離抑制による抗アレルギー作用と特異的H₁受容体拮抗による抗ヒスタミン作用を示す。

* 2. 動物鼻炎モデルにおける作用

<生物学的同等性試験>(アレルギー性鼻炎モデルに対する効果)

- (1) 抗卵白アルブミン(ovalbumin:OA)血清により感作したラットに対して、ケトチフェン点鼻液0.05%「TOA」及び標準製剤(点鼻液)を点鼻した後に、OAリン酸緩衝液によりアレルギー反応を誘発し、色素漏出量を指標として鼻汁分泌の抑制作用を比較した。その結果、両剤ともControl(注射用水)に対し有意に鼻汁分泌を抑制し、両剤間では有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

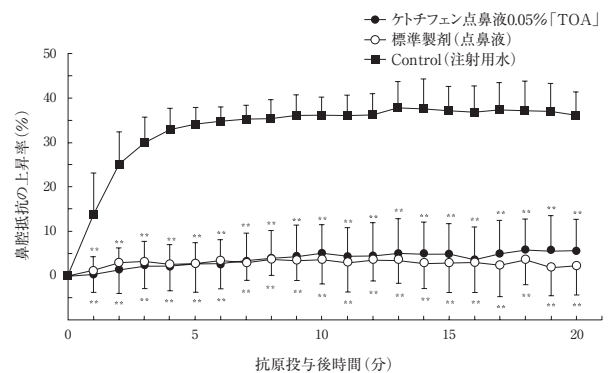
ラット鼻炎モデルに対する効果



平均値±標準偏差, n = 10
*: p < 0.05, **: p < 0.01, vs Control (注射用水)
N.S.: 有意差なし, vs 標準製剤
Tukey検定

- (2) 抗卵白アルブミン(ovalbumin:OA)血清により感作したモルモットに対して、ケトチフェン点鼻液0.05%「TOA」及び標準製剤(点鼻液)を点鼻した後に、OA生理食塩液によりアレルギー反応を誘発し、鼻腔抵抗の上昇率を指標としてその抑制作用を比較した。その結果、両剤ともControl(注射用水)に対し有意に鼻腔抵抗上昇を抑制し、両剤間では有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

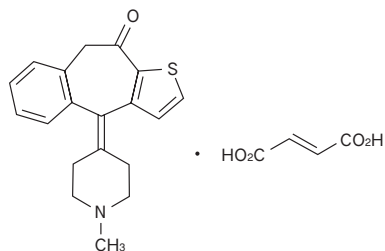
モルモット鼻炎モデルの鼻腔抵抗上昇に対する効果



平均値±標準偏差, n = 8
**: p < 0.01, vs Control (注射用水), Tukey検定

***【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 · C₄H₄O₄
分子量：425.50
融点：約190℃(分解)
構造式：



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。

***【取扱い上の注意】**

安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ケトチフェン点鼻液0.05%「TOA」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。²⁾

【包装】

ケトチフェン点鼻液0.05%「TOA」：8 mL×10本

***【主要文献及び文献請求先】**

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

<主要文献>

- 1) 東亜薬品株式会社：ケトチフェン点鼻液0.05%「TOA」の生物学的同等性試験(社内資料)
- 2) 東亜薬品株式会社：ケトチフェン点鼻液0.05%「TOA」の安定性試験(社内資料)

<文献請求先>

本草製薬株式会社 学術部
〒468-0046 名古屋市天白区古川町125番地
TEL 052-892-1287
FAX 052-895-4928

販売
本草製薬株式会社
名古屋市天白区古川町125番地

製造販売元
東亜薬品株式会社
富山県富山市水橋開発277番10