

アレルギー性疾患治療剤

***ケトチフェン**カプセル1mg「**サワイ**」

KETOTIFEN

ケトチフェンフマル酸塩カプセル

貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示

日本標準商品分類番号

8 7 4 4 9

* 承認番号	22500AMX00921000
薬価収載	2013年12月
販売開始	1994年7月

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

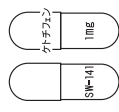
- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) てんかん又はその既往歴のある患者〔痙攣閾値を低下させることがある。〕

【組成・性状】

組成

ケトチフェンカプセル1mg「サワイ」は、1カプセル中に日局ケトチフェンフマル酸塩1.38mg(ケトチフェンとして1mg)を含有する。添加物として、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、乳糖、カプセル本体に、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸Naを含有する。

製剤の性状

剤形	外形 全長(mm)・重量(mg)・カプセル号数	性状
硬カプセル剤	 14.5 約170 4 [識別コード：SW-141]	頭部：白色不透明 胴部：白色不透明 内容物：白色～淡黄白色の粉末 においはなく、味は苦い

【効能・効果】

気管支喘息

アレルギー性鼻炎

湿疹・皮膚炎、蕁麻疹、皮膚痒痒症

【用法・用量】

通常、成人にはケトチフェンとして1回1mg(1カプセル)を1日2回、朝食後及び就寝前に経口投与する。
なお、年齢・症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

てんかんを除く痙攣性疾患、又はこれらの既往歴のある患者〔痙攣閾値を低下させることがある。〕(「禁忌」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- 1) 気管支喘息に用いる場合、本剤はすでに起こっている発作を速やかに軽減する薬剤ではないので、このことを患者に十分説明しておく必要がある。
- 2) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量をはかる場合は十分な管理下で徐々に行うこと。
- 3) 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。

3. 相互作用

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
中枢神経抑制剤 鎮静剤 催眠剤 等 抗ヒスタミン剤 アルコール	眠気、精神運動機能低下等を起こすことがある。 アルコール性飲料の摂取を制限すること。	いずれも中枢神経抑制作用を有するため。

4. 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。

1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) **痙攣、興奮**：痙攣、興奮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し、適切な処置を行うこと(乳児、幼児では特に注意すること)。
- (2) **肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、LDH、 γ -GTPの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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し、適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

	頻度不明
泌尿器 ^{注)}	頻尿、排尿痛、血尿、残尿感等の膀胱炎様症状
過敏症 ^{注)}	浮腫、多形紅斑、発疹、蕁麻疹
精神神経系	一過性の意識消失 ^{注)} 、易刺激性、不眠、神経過敏、鎮静、眠気、倦怠感、口渇、めまい、ふらつき、頭痛、味覚異常、しびれ感
消化器	悪心、腹痛、下痢、嘔吐、胃部不快感、食欲不振、便秘、口内炎
肝臓	LDH、 γ -GTP、AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの上昇
その他	ほてり、動悸、月経異常、体重増加、鼻出血

注)このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

6. 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。〕

7. 小児等への投与

乳児、幼児に投与する場合には、観察を十分に行い慎重に投与すること。〔痙攣、興奮等の中枢神経症状があらわれることがある。〕

8. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルゲン皮内反応を抑制するため、アレルゲン皮内反応検査を実施する3～5日前より本剤の投与を中止することが望ましい。

9. 過量投与

- 1) 徴候、症状：傾眠、見当識障害、チアノーゼ、呼吸困難、発熱、錯乱、痙攣、頻脈、徐脈、低血圧、眼振、可逆性昏睡等。特に小児では、興奮性亢進、痙攣。
- 2) 処置：一般的な薬物除去法(催吐、胃洗浄、活性炭投与等)により、本剤を除去する。また必要に応じて対症療法を行う。

10. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)

【薬物動態】

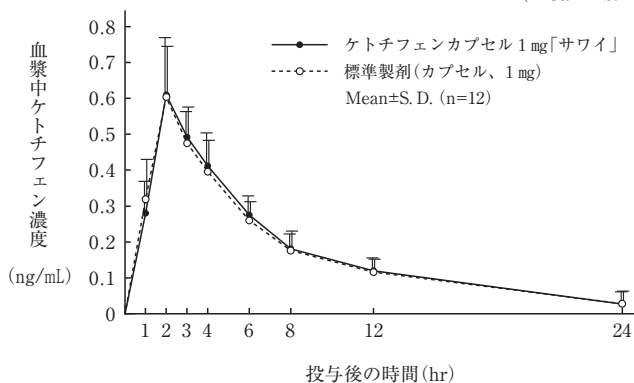
1. 生物学的同等性試験

ケトチフェンカプセル1mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ2カプセル(ケトチフェンとして2mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ケトチフェン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

各製剤2カプセル投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-24hr} (ng·hr/mL)
ケトチフェンカプセル 1mg「サワイ」	0.62 ± 0.15	2.2 ± 0.4	7.2 ± 2.8	4.22 ± 0.67
標準製剤 (カプセル、1mg)	0.60 ± 0.14	2.0 ± 0.0	7.1 ± 4.4	4.15 ± 0.93

(Mean ± S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 溶出挙動

本製剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

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C₄・D₄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。²⁾

【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)

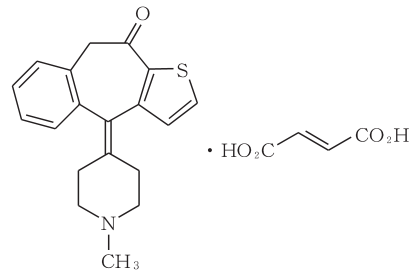
化学名：4-(1-Methylpiperidin-4-ylidene)-4H-benzo[4,5]cyclohepta[1,2-b]thiophen-10(9H)-one monofumarate

分子式：C₁₉H₁₉NOS·C₄H₄O₄

分子量：425.50

融点：約190℃(分解)

構造式：



性状：ケトチフェンフマル酸塩は白色～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
PTP包装したものをを用いた長期保存試験(室温、3年間)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。³⁾

**【包装】

PTP：100カプセル(10Cap×10)

【主要文献及び文献請求先】

* 主要文献

- 1) 沢井製薬(株)社内資料 [生物学的同等性試験]
- 2) 第十七改正日本薬局方解説書、廣川書店、2016、C-1815.
- 3) 沢井製薬(株)社内資料 [安定性試験]

・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

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：06-6394-7355

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

K12 A190913