

日本標準商品分類番号
871319

抗アレルギー点眼剤

貯 法	室温保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること

ザジテン®点眼液0.05%

Zaditen® Ophthalmic Solution 0.05%

（ケトチフェンフマル酸塩点眼液）

承認番号	21900AMX01049000
薬価基準収載年月	2007年12月
販売開始年月	1991年7月
再審査結果年月	1999年3月

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

品名	ザジテン®点眼液0.05%
成分・含量	1 mL中日局ケトチフェンフマル酸塩 0.69mg (ケトチフェンとして0.50mg)
添加物	ベンザルコニウム塩化物、グリセリン、 水酸化ナトリウム、塩酸
性状	無色～微黄色澄明の無菌に製した水性 点眼液で、においはないか、又はわず かに特異なおいがある。
pH	4.8～5.8
浸透圧比 (生理食塩液に対する比)	0.7～1.0

【効能・効果】

アレルギー性結膜炎

【用法・用量】

通常1回1～2滴を1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）
点眼する。

【使用上の注意】

1. 副作用

総症例6,557例中、副作用が認められたのは220例
(3.36%)であった。主な副作用はしみる・眼刺激171件
(2.61%)、眼瞼炎18件 (0.27%)、眠気18件 (0.27%) 等
であった。（再審査終了時までの集計）

	頻度不明	0.1%～5%未満	0.1%未満
過敏症	発疹、眼部腫 脹、眼瞼浮腫、 顔面浮腫	眼瞼炎、眼瞼皮膚 炎、そう痒感	—
眼	眼痛、霧視、 眼乾燥、結膜 炎、羞明	結膜充血、刺激感	角膜びらん
その他	頭痛、口渇	眠気	—

副作用が認められた場合には、投与を中止するなど適切な
処置を行うこと。

2. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。〕

3. 適用上の注意

- (1) 投与経路：点眼用にのみ使用すること。
- (2) 投与時：
 - 1) 点眼した時に液が眼瞼皮膚等についた場合は、
すぐにふき取るよう指導すること。
 - 2) 薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先
端が直接目に触れないように注意するよう指
導すること。
 - 3) ベンザルコニウム塩化物によりソフトコンタ
クトレンズを変色させることがあるので、ソ
フトコンタクトレンズを装着している場合は、
点眼前にレンズを外し、点眼15分以上経過後
に再装着すること。

【薬物動態】

（参考：動物）

眼組織内移行¹⁾

¹⁴C-ケトチフェンフマル酸塩をウサギに1回点眼投与し、眼
組織及び血中への移行性を検討した。

眼組織における濃度は投与後15分に最高値を示した。最も高
い濃度を示したのは角膜（上皮）で、次いで結膜、角膜（内
皮及び実質）、虹彩、強膜（前部）、毛様体、外眼筋、前房水
の順であった。

他の眼組織中の平均滞留時間が3時間以下であるのに比べ、
結膜では平均滞留時間が5.7時間と長い値を示した。

点眼投与によっても血中への移行がみられたが低値であっ
た。頻回投与した場合の定常状態における血中濃度は、結膜
中の濃度の1/70程度と予測された。

【臨床成績】^{2～4)}

二重盲検比較試験を含むアレルギー性結膜炎における本剤の
臨床試験成績の概要は次のとおりである。

本剤の臨床効果判定は、自覚症状（そう痒感、流涙等）及
び他覚所見（充血、浮腫等）を調査して行った。有効率は
69.1% (192/278) であった。また、二重盲検比較試験にお
いて本剤の有用性が確認された。

【薬効薬理】

1. 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）⁵⁾。

ヒスタミン、SRS-A等の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*）^{5～7)}。

また、抗原及び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⁸⁾、ヒヒ⁹⁾）。

2. 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⁵⁾。

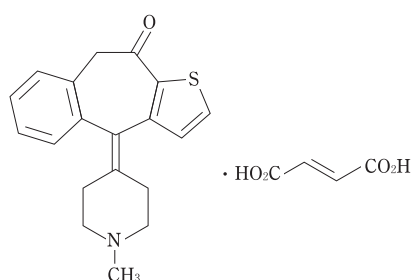
3. 動物結膜炎モデルにおける作用

動物結膜炎モデルにおいてケトチフェンはIgE結膜炎（ラット、モルモット、点眼）及びCompound48/80誘発結膜炎を抑制する（ラット、点眼）¹⁰⁾。

抗原誘発により結膜炎症状とともに好酸球、好中球の結膜浸潤がみられるが、ケトチフェンはこれを抑制する（モルモット、点眼）¹¹⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



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

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）

分配係数：0.7（1-オクタノール/0.1mol/L塩酸）

**【包 装】

ザジテン[®]点眼液0.05% 5 mL×10本（プラスチック製瓶入）

【主要文献】

- 1) 太田真一ほか：臨床医薬 **4**(11), 2183, 1988
〔ZENJ00850〕
- 2) 三国郁夫ほか：臨床医薬 **4**(12), 2371, 1988
〔ZENJ00847〕
- 3) 藤田善史ほか：臨床医薬 **5**(4), 709, 1989
〔ZENJ00923〕
- 4) 石崎道治ほか：Prog. Med. **9**(5), 1625, 1989
〔ZENJ00932〕
- 5) Martin, U. et al. : Arzneim. -Forsch. **28**(5), 770, 1978
〔ZENM00019〕
- 6) 熊谷 朗ほか：メディカルサンド **8**(2), 87, 1980
〔ZENJ00016〕

- 7) 岸本真知子ほか：アレルギーの臨床 **4**(2), 149, 1984
〔ZENJ00110〕
- 8) Morley, J. et al. : Agents. Actions. Suppl. **23**, 187, 1988
〔ZENM01112〕
- 9) Arnoux, B. et al. : Am. Rev. Respir. Dis. **137**(4), 855, 1988
〔ZENM00894〕
- 10) 山口 武ほか：医薬品研究 **20**(1), 48, 1989
〔ZENJ00900〕
- 11) 石崎道治：アレルギー **35**(12), 1149, 1986
〔ZENJ00492〕

*【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

ノバルティスファーマ株式会社 ノバルティスダイレクト
〒105-6333 東京都港区虎ノ門1-23-1

NOVARTIS DIRECT

0120-003-293

受付時間：月～金 9：00～17：30
（祝祭日及び当社休日を除く）

www.novartis.co.jp

(12)

製造販売

ノバルティス ファーマ株式会社

東京都港区虎ノ門 1-23-1