

貯 法：室温保存  
 使用期限：外箱等に表示  
 注 意：【取扱い上の注意】の項参照

アレルギー性疾患治療剤

承認番号	22900AMX00051000
薬価収載	2017年6月
販売開始	2017年6月

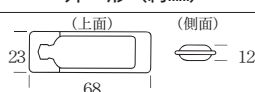
# ケトチフェンシロップ0.02% 「日医工」

Ketotifen Fumarate Syrup 0.02%  
 (ケトチフェンフマル酸塩シロップ)

## 【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】

成分・含量	添加物	剤形	外観性状	pH
1包(2mL)中 日局 ケトチフェンフマル酸塩0.552mg (ケトチフェンとして0.4mg)	リン酸水素Na、クエン酸、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、白糖、D-ソルビトール、香料、グリセリン、エタノール	シロップ剤	無色～微黄色澄明の粘性の液で、芳香があり、味は甘い。分包装である。	4.5 ～ 5.5
1包(3mL)中 日局 ケトチフェンフマル酸塩0.828mg (ケトチフェンとして0.6mg)				
1包(5mL)中 日局 ケトチフェンフマル酸塩1.38mg (ケトチフェンとして1.0mg)				
外形（約mm）			識別コード	
			OS36	

## 【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、皮膚掻痒症

## 【用法・用量】

通常、小児には1日量0.3mL/kg（ケトチフェンとして0.06mg/kg）を2回、朝食後及び就寝前に分けて経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。年齢別の標準投与量は、通常、下記の用量を1日量とし、1日2回、朝食後及び就寝前に分けて経口投与する。

6箇月以上3歳未満：4mL（ケトチフェンとして0.8mg）  
 3歳以上7歳未満：6mL（ケトチフェンとして1.2mg）  
 7歳以上：10mL（ケトチフェンとして2.0mg）

ただし、1歳未満の乳児に使用する場合には体重、症状などを考慮して適宜投与量を決めること。

## 【使用上の注意】

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

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. 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。]

## 6. 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。]

## 7. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルギー皮内反応を抑制するため、アレルギー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。

## 8. 過量投与

**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。

**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。

## 9. 適用上の注意

- (1)投与経路：内服用にのみ使用させること。
- (2)服用時：開封後は速やかに服用し、残液は廃棄させること。

### 使用方法

1回分を切り離し、容器を立てた状態で矢印の方向にゆっくりと回し、開けてください。



1回分を切り離します。

立てたまま、ゆっくり回して開封します。

軽く押しながら服用してください。

### 【薬物動態】

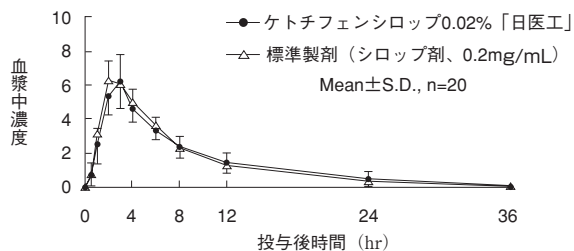
#### 生物学的同等性試験

ケトチフェンシロップ0.02%「日医工」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ10mL（ケトチフェンとして2mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中ケトチフェン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について分散分析法に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。<sup>1)</sup>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→36</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ケトチフェンシロップ0.02%「日医工」	51.6 ± 13.4	6.90 ± 1.39	2.5 ± 0.5	8.1 ± 3.9
標準製剤（シロップ剤、0.2mg/mL）	51.6 ± 12.9	6.97 ± 1.57	2.3 ± 0.6	7.1 ± 3.9

(Mean ± S.D., n=20)

(ng/mL)



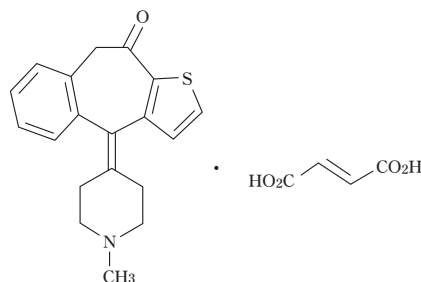
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

### 【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

構造式：



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）

### 【取扱い上の注意】

#### 1. 取扱い上の注意

- (1)誤用を避けるため、他の容器に移しかえて保存しないこと。
- (2)光を避けて保存すること。
- (3)小児の手のとどかないところに保管すること。

#### 2. 安定性試験

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、ケトチフェンシロップ0.02%「日医工」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。<sup>2)</sup>

### 【包装】

ケトチフェンシロップ0.02%「日医工」

0.4mg/2mL×144包、0.6mg/3mL×144包、1.0mg/5mL×144包

### 【主要文献】

- 1)日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2)日医工株式会社 社内資料：安定性試験

### 【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

高田製薬株式会社 学術部

〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

発売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1

製造販売元  日医工株式会社  
NICHIIKO 富山市総曲輪1丁目6番21