

アレルギー性疾患治療剤

ケトチフェンシロップ0.02%「TYK」

ケトチフェンフマル酸塩シロップ

KETOTIFEN Syrup 0.02%「TYK」

貯 法：室温保存

使用期限：3年（外箱、ラベルに表示）

承認番号	22000AMX02217
薬価収載	2008年12月
販売開始	1999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】

販 売 名	ケトチフェンシロップ0.02%「TYK」
成 分	日局 ケトチフェンフマル酸塩
含量（1 mL中）	0.276mg（ケトチフェンとして0.2mg）
添 加 物	パラベン、エタノール、グリセリン、酒石酸、クエン酸Na水和物、白糖、D-ソルビトール、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、香料
性 状	無色～微黄色澄明の液で、芳香があり、味は甘い。
比 重	d_{20}^{20} ：約1.2
pH	4.5～5.5

【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。

年齢	1日用量
6ヵ月以上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】

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

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。〕

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。

【薬物動態】

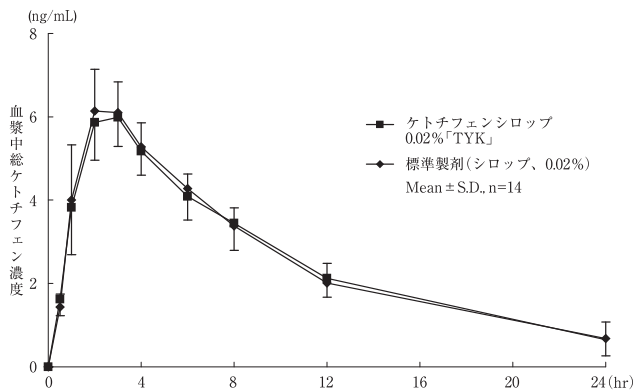
生物学的同等性試験¹⁾

ケトチフェンシロップ0.02%「TYK」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^{*}）を健康成人に空腹時単回経口投与して血漿中総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、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。

※本剤の承認された1日用量は、通常、小児には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の投与である。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0~24} (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ケトチフェンシロップ0.02%「TYK」	62.7±10.0	6.16±0.72	2.50±0.52	7.01±1.45
標準製剤（シロップ、0.02%）	62.7±7.9	6.41±0.94	2.50±0.52	7.24±2.41

(Mean±S.D., n=14)



ケトチフェンシロップ0.02%「TYK」(10mL)投与後の血漿中濃度の推移

血漿中濃度並びに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。

【薬効薬理】

ケトチフェンフマル酸塩は、ケミカルメディエーター遊離抑制に基づく抗アナフィラキシー作用に加え、抗ヒスタミン作用、抗SRS-A作用及び抗PAF（血小板活性化因子）作用を有し、気道及び鼻粘膜等の組織の過敏性を減弱させる。更に、抗原/PAF刺激による好酸球の肺への集積とそこでの脱顆粒を抑制する作用もあり、また、抗原により誘発される結膜炎症状や鼻粘膜反応も抑制する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 (JAN)

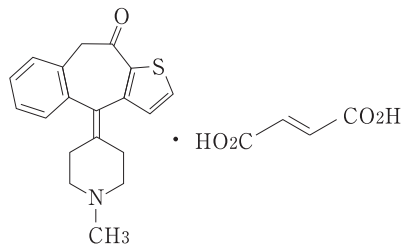
〔別名〕 フマル酸ケトチフェン

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

構造式：



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】

安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温保存、3年3ヵ月）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、本剤は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。

【包装】

ケトチフェンシロップ0.02%「TYK」：500mL

*【主要文献】

- 1) 武田テバ薬品(株)：社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 第十五改正日本薬局方解説書，廣川書店 2006；C-1383
- 3) 武田テバ薬品(株)：社内資料(安定性試験)

*【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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。

武田テバ薬品株式会社 武田テバDIセンター
〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号
TEL 0120-923-093

受付時間 9:00～17:30（土日祝日・弊社休業日を除く）

※ 販 売 **武田薬品工業株式会社**
大阪市中央区道修町四丁目1番1号

※ 発売元 **武田テバファーマ株式会社**
名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

※ 製 造 **武田テバ薬品株式会社**
※ 販売元 大阪市中央区道修町四丁目1番1号