

※※ **ケトチフェンカプセル 1mg「ツルハラ」**

※※ **ケトチフェンDS小児用 0.1%「ツルハラ」**

Ketotifen Cap.1mg/DS 0.1%「TSURUHARA」


	カプセル	DS小児用
※※ 承認番号	30200AMX 00004000	30100AMX 00402000
※※ 薬価収載	2020年6月	
※※ 販売開始	1992年7月	

貯法	室温保存
使用期限	外箱、容器に表示

【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】

	カプセル 1mg	DS小児用 0.1%
組成	1カプセル中 ケトチフェンフマル酸塩 1.38mg (ケトチフェンとして1mg)	1g中 ケトチフェンフマル酸塩 1.38mg (ケトチフェンとして1mg)
添加物	乳糖水和物、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸 カプセル本体中 ラウリル硫酸ナトリウム、酸化チタン、ゼラチン	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、香料、白糖、軽質無水ケイ酸、酸化チタン、ヒドロキシプロピルセルロース、モノステアリン酸グリセリン、ソルビタンセスキオレイン酸エステル
※ 製剤の性状	白色～淡黄白色の粉末の入った頭部・胴部とも白色不透明の4号硬カプセル剤で識別記号は TSU703である。 長さ：約 14.0mm 直径：約 5.4mm 質量：約 175mg 	白色のシロップ剤で芳香を有する。

【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、皮膚癢痒症

【用法・用量】

ケトチフェンカプセル 1mg「ツルハラ」

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。

ケトチフェンDS小児用 0.1%「ツルハラ」

通常、小児には1日量 0.06g/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、用時溶解して経口投与する。

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、経口投与する。

年齢	1日用量
6か月以上3歳未満	0.8g (ケトチフェンとして0.8mg)
3歳以上7歳未満	1.2g (ケトチフェンとして1.2mg)
7歳以上	2.0g (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定めること。

【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

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	眠気、精神運動機能低下等を起こすことがある。	いずれも中枢神経抑制作用を有するため。
抗ヒスタミン剤 アルコール	アルコール性飲料の摂取を制限すること。	

(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*	頻尿、排尿痛、血尿、残尿感等の膀胱炎様症状
過敏症*	発疹、蕁麻疹、浮腫、多形紅斑
精神神経系	眠気、倦怠感、口渇、めまい、ふらつき、頭痛、味覚異常、しびれ感、一過性の意識消失*、易刺激性、不眠、神経過敏、鎮静
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	AST(GOT)の上昇、ALT(GPT)の上昇、Al-Pの上昇、LDHの上昇、γ-GTPの上昇
その他	体重増加、鼻出血、ほてり、動悸、月経異常

*：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。

(9) 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。

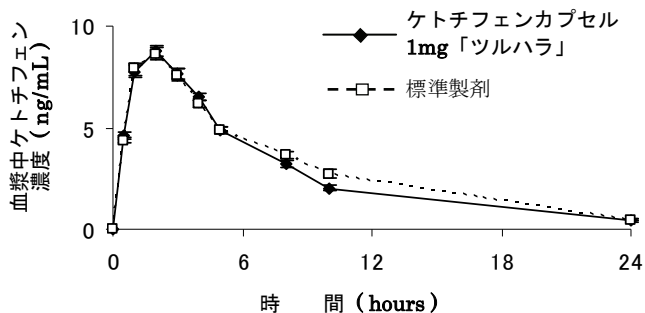
(10) 適用上の注意

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、更には穿孔を起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】

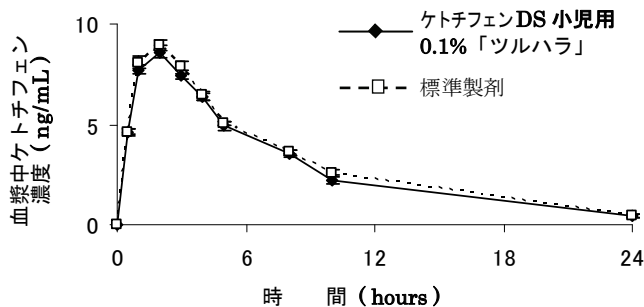
(1) 生物学的同等性試験

ケトチフェンカプセル 1mg「ツルハラ」¹⁾、ケトチフェン DS 小児用 0.1%「ツルハラ」²⁾ あるいはそれぞれの標準製剤をクロスオーバー法により、ケトチフェンとして 2mg*（カプセル 2 カプセル、ドライシロップ 2g）を健康成人男子に絶食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、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。（*本剤の承認された通常成人に対する用量は 1 回 1mg である。）



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ケトチフェンカプセル 1mg「ツルハラ」	68.4 ± 2.1	8.8 ± 0.2	2.0 ± 0.1	3.9 ± 0.2
標準製剤 (カプセル、1mg)	74.3 ± 2.5	8.9 ± 0.3	2.2 ± 0.1	6.2 ± 0.8

(Mean ± S.E., n=12)



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ケトチフェン DS 小児用 0.1%「ツルハラ」	70.3 ± 2.4	8.6 ± 0.3	2.1 ± 0.1	4.5 ± 0.4
標準製剤 (ドライシロップ、0.1%)	74.0 ± 2.0	9.2 ± 0.2	2.1 ± 0.1	5.3 ± 0.6

(Mean ± S.E., n=12)

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。

(2) 溶出挙動

ケトチフェンカプセル 1mg「ツルハラ」³⁾、ケトチフェン DS 小児用 0.1%「ツルハラ」⁴⁾ は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたケトチフェンフマル酸塩カプセル・ドライシロップの溶出規格に適合していることが確認されている。

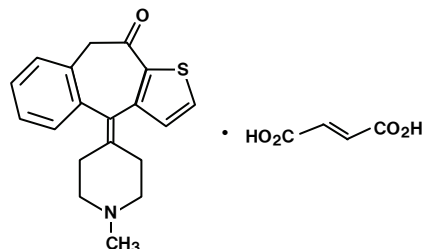
※※

【薬効薬理】

ケトチフェンは、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⁵⁾。

【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：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。

融点：約 190℃（分解）

【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 ヶ月）の結果、ケトチフェンカプセル 1mg「ツルハラ」⁶⁾、ケトチフェン DS 小児用 0.1%「ツルハラ」⁷⁾ 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。

【包装】

ケトチフェンカプセル 1mg「ツルハラ」
（PTP） 100 カプセル、1200 カプセル
ケトチフェン DS 小児用 0.1%「ツルハラ」
（バラ） 200g

【主要文献】

- 1) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 2) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 3) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 4) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 5) 第十七改正日本薬局方解説書（広川書店）C-1818 (2016)
- 6) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 7) 鶴原製薬株式会社 社内資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料についても下記へご請求ください。
鶴原製薬株式会社 医薬情報部
〒563-0036 大阪府池田市豊島北 1 丁目 1 6 番 1 号
TEL：072-761-1456（代表） FAX：072-760-5252



製造販売元
鶴原製薬株式会社

大阪府池田市豊島北 1 丁目 16 番 1 号

(M28)
M29)-23 20-2004
A004-S