

貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示(期限内に使用すること。)

アレルギー性疾患治療剤

ケトチフェンシロップ0.02%「杏林」

KETOTIFEN Syrup 0.02% “KYORIN”

(ケトチフェンフマル酸塩シロップ)

承認番号	22900AMX00594000
薬価収載	2017年12月
販売開始	1992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】

成分・分量 (1mL中)	ケトチフェンとして0.2mg (日局ケトチフェンフマル酸塩 0.276mg)
添加物	D-ソルビトール、水アメ、白糖、クエン酸水和物、クエン酸ナトリウム水和物、メチルパラベン、プロピルパラベン、香料、プロピレングリコール
剤形	シロップ剤
色調	無色～微黄色澄明
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才未満	4mL(ケトチフェンとして0.8mg)
3才以上7才未満	6mL(ケトチフェンとして1.2mg)
7才以上	10mL(ケトチフェンとして2.0mg)

ただし、1才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、 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

分類	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)} 、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、けん怠感、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、 γ -GTP、AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの上昇
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。

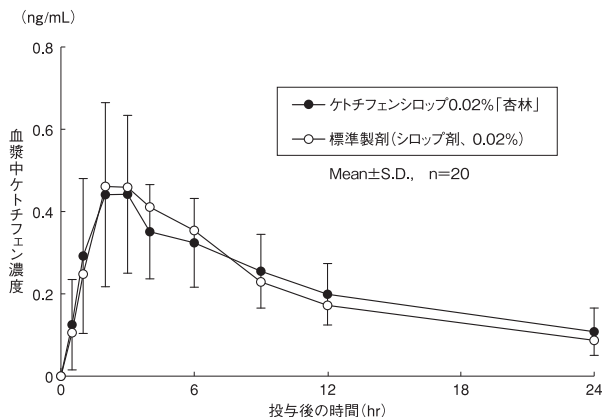
【薬物動態】

生物学的同等性試験¹⁾

ケトチフェンシロップ0.02%「杏林」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未変化体濃度を測定し、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。

	判定パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)
ケトチフェンシロップ 0.02%「杏林」	5.40±1.87	0.51±0.21
標準製剤 (シロップ剤、0.02%)	5.15±1.97	0.52±0.18

(Mean±S.D., n=20)



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】

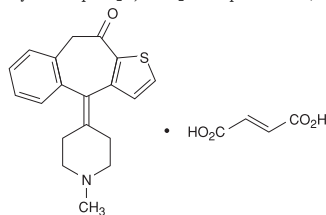
ヒスタミンおよびSRS-A等のケミカルメディエーター遊離抑制に基づく抗アナフィラキシー作用、抗ヒスタミン作用および抗SRS-A作用を有し、また、気道および鼻粘膜等の組織の過敏性を減弱させる。さらにPAF(血小板活性化因子)による気道の反応性亢進を抑制する。

【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：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】

1. 注意

本剤と他剤との配合は、できるだけ避けることが望ましいが、やむを得ず配合する場合には、下記の品目はできるだけ速やかに服用すること。

ケフラール細粒

2. 安定性試験²⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、3年間)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ケトチフェンシロップ0.02%「杏林」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】

500mL

【主要文献】

1)キョーリンリメディオ株式会社社内資料：

ケトチフェンシロップ0.02%「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料

2)キョーリンリメディオ株式会社社内資料：

ケトチフェンシロップ0.02%「杏林」の安定性試験に関する資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料は下記にご請求下さい。

キョーリンリメディオ株式会社 学術部

〒920-0017 金沢市諸江町下丁287番地1

TEL 0120-960189

FAX 0120-189099

販売元

杏林製薬株式会社

東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地

製造販売元

キョーリンリメディオ株式会社

富山県南砺市井波885番地