

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

抗アレルギー点眼剤  
ケトチフェンフマル酸塩点眼液

## ケトチフェン点眼液 0.05%「ニッテン」

Ketotifen Ophthalmic Solution

剤形	水性点眼剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL 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)
一般名	和名：ケトチフェンフマル酸塩(JAN) 洋名：Ketotifen Fumarate(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2018年12月28日(販売名変更による) 薬価基準収載年月日：2019年6月14日(販売名変更による) 販売開始年月日：1999年7月12日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：ロートニッテン株式会社 製造販売元：ロートニッテンファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ロートニッテン株式会社 医薬情報問合せ窓口 TEL 0120(691)910 FAX 052(823)9115 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.rohto-nitten.co.jp/">https://www.rohto-nitten.co.jp/</a>

本 IF は 2023 年 10 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂しました。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

－ 日本病院薬剤師会 －

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IF と略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

## 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b>		<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b>	
1. 開発の経緯	1	1. 薬理的に関連ある化合物 又は化合物群	8
2. 製品の治療学的特性	1	2. 薬理作用	8
3. 製品の製剤学的特性	1	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b>	
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	1. 血中濃度の推移	10
5. 承認条件 及び流通・使用上の制限事項	1	2. 薬物速度論的パラメータ	10
6. RMPの概要	1	3. 母集団（ポピュレーション）解析	10
<b>II. 名称に関する項目</b>		4. 吸収	10
1. 販売名	2	5. 分布	11
2. 一般名	2	6. 代謝	11
3. 構造式又は示性式	2	7. 排泄	11
4. 分子式及び分子量	2	8. トランスポーターに関する 情報	11
5. 化学名（命名法）又は本質	2	9. 透析等による除去率	11
6. 慣用名、別名、略号、 記号番号	2	10. 特定の背景を有する患者	12
<b>III. 有効成分に関する項目</b>		11. その他	12
1. 物理化学的性質	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する 項目</b>	
2. 有効成分の各種条件下 における安定性	3	1. 警告内容とその理由	13
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	2. 禁忌内容とその理由	13
<b>IV. 製剤に関する項目</b>		3. 効能又は効果に関連する 注意とその理由	13
1. 剤形	4	4. 用法及び用量に関連する 注意とその理由	13
2. 製剤の組成	4	5. 重要な基本的注意とその理由	13
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	6. 特定の背景を有する患者に関する 注意	13
4. 力価	4	7. 相互作用	14
5. 混入する可能性のある 夾雑物	4	8. 副作用	14
6. 製剤の各種条件下における 安定性	5	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	14
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	10. 過量投与	14
8. 他剤との配合変化 （物理化学的変化）	5	11. 適用上の注意	14
9. 溶出性	5	12. その他の注意	15
10. 容器・包装	5		
11. 別途提供される資材類	5		
12. その他	5		
<b>V. 治療に関する項目</b>			
1. 効能又は効果	6		
2. 効能又は効果に関連する注意	6		
3. 用法及び用量	6		
4. 用法及び用量に関連する注意	6		
5. 臨床成績	6		

## IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験 ..... 16
2. 毒性試験 ..... 16

## X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分 ..... 17
2. 有効期間 ..... 17
3. 包装状態での貯法 ..... 17
4. 取扱い上の注意 ..... 17
5. 患者向け資材 ..... 17
6. 同一成分・同効薬 ..... 17
7. 国際誕生年月日 ..... 17
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 ..... 17
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 ..... 17

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 ..... 18
11. 再審査期間 ..... 18
12. 投薬期間制限に関する情報 ..... 18
13. 各種コード ..... 18
14. 保険給付上の注意 ..... 18

## X I. 文献

1. 引用文献 ..... 19
2. その他の参考文献 ..... 19

## X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況 ..... 20
2. 海外における臨床支援情報 ..... 20

## X III. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して 臨床判断を行うにあたっての参考情報 ..... 21
2. その他の関連資料 ..... 21

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

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、抗ヒスタミン作用及び抗 PAF(血小板活性化因子)作用を有し、アレルギー症状を緩和する。

本剤は、ケトチフェンフマル酸塩を有効成分とする抗アレルギー点眼剤である。フマルトン点眼液の販売名で規格及び試験方法を設定し、生物学的同等性試験(薬力学的試験)、加速試験を行い、後発医薬品として1998年12月に承認を取得、1999年7月に販売開始した。

また、2000年9月19日付医薬発第935号「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」の通知等に基づき、2008年3月にフマルトン点眼液0.05%の販売名で再承認を取得し、2008年6月に薬価収載となった。

さらに、2018年12月にケトチフェン点眼液0.05%「ニッテン」の販売名で再承認を取得し、2019年6月に薬価収載となった。

### 2. 製品の治療学的特性

#### (1) 有効性

ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体にヒスタミンが結合するのを防ぐこと及びマスト細胞からヒスタミン等の化学伝達物質の遊離を抑制することにより抗アレルギー作用を示す。

#### (2) 安全性

ケトチフェンフマル酸塩点眼液の副作用として眼瞼炎、眼瞼皮膚炎、そう痒感、結膜充血、刺激感、眠気等が報告されている。

### 3. 製品の製剤学的特性

なし

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	—
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	—
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	無	—

### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

#### (1) 承認条件

該当しない

#### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

### 6. RMPの概要

該当しない

## Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

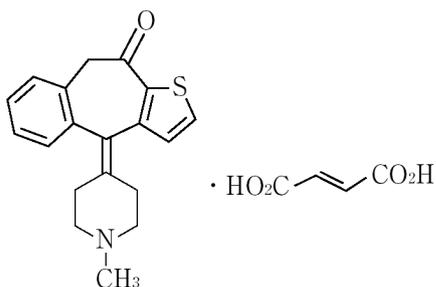
- (1) 和名  
 ケトチフェン点眼液 0.05% 「ニッテン」
- (2) 洋名  
 Ketotifen Ophthalmic Solution
- (3) 名称の由来  
 特になし

2. 一般名

- (1) 和名 (命名法)  
 ケトチフェンフマル酸塩 (JAN)
- (2) 洋名 (命名法)  
 Ketotifen Fumarate (JAN)
- (3) ステム  
 不明

3. 構造式又は示性式

構造式



4. 分子式及び分子量

分子式 :  $C_{19}H_{19}NOS \cdot C_4H_4O_4$   
 分子量 : 425.50

5. 化学名 (命名法) 又は本質

4-(1-Methylpiperidin-4-ylidene)-4*H*-benzo[4,5]cyclohepta  
 [1,2-*b*]thiophen-10(9*H*)-one monofumarate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、  
 記号番号

別名 : フマル酸ケトチフェン

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状<sup>1)</sup>

白色～淡黄白色の結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性<sup>1)</sup>

溶 媒	日本薬局方の表現
メタノール	やや溶けにくい
酢酸(100)	やや溶けにくい
水	溶けにくい
エタノール(99.5)	溶けにくい
無水酢酸	溶けにくい

##### (3) 吸湿性<sup>2)</sup>

40℃・75%RHで4ヵ月間又は50℃・75%RHで2ヵ月間ガラス瓶（開栓）に保存したときの吸湿量は0.1～0.2%であった。

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点<sup>1)</sup>

融点：約190℃（分解）

##### (5) 酸塩基解離定数<sup>2)</sup>

pKa=6.05（水(1)：エタノール(95)(1)の混液、0.1モル塩酸で滴定）

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

##### (1) 確認試験法

日局「ケトチフェンフマル酸塩」による

##### (2) 定量法

日局「ケトチフェンフマル酸塩」による

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

- (1) 剤形の区別  
水性点眼剤
- (2) 製剤の外観及び性状  
無色～微黄色澄明、無菌水性点眼剤
- (3) 識別コード  
該当しない
- (4) 製剤の物性  
pH : 4.8 ~ 5.8  
浸透圧比 : 0.7 ~ 1.0
- (5) その他  
無菌製剤である。

### 2. 製剤の組成

- (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤  
有効成分の含量 : 1mL 中 ケトチフェンフマル酸塩を 0.69mg  
(ケトチフェンとして 0.50mg) 含有  
添加剤 : グリセリン、ポビドン、ポリオキシエチレンヒマシ油、  
ベンザルコニウム塩化物、トロメタモール
- (2) 電解質等の濃度  
該当しない
- (3) 熱量  
該当しない

### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

### 4. 力価

該当しない

### 5. 混入する可能性のある 夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における  
安定性

加速試験<sup>3)</sup>

試験条件：5mL プラスチック製点眼容器、40℃、75%RH

3ロット、n=3 で試験を実施

	開始時	2ヵ月後	4ヵ月後	6ヵ月後
性状 (無色～微黄色澄明の 液で、においはないか、 又はわずかに特異な においがある)	無色澄明の 液でにおい はない	無色澄明の 液でにおい はない	無色澄明の 液でにおい はない	無色澄明の 液でにおい はない
pH (4.8～5.8)	5.2	5.1	5.1	5.1
浸透圧比 (0.7～1.0)	0.8	0.8	0.8	0.8
含量 (%) ※	101.0～101.3	99.0～99.3	97.6～98.7	98.7～100.2

※表示量に対する割合

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化  
(物理化学的変化)

該当資料なし

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に  
関する情報

該当しない

(2) 包装

プラスチック点眼容器 5mL×10本

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

	容器	中栓	キャップ
プラスチック容器	ポリエチレン	ポリエチレン	ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

投薬袋

12. その他

該当しない

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	アレルギー性結膜炎
2. 効能又は効果に関連する注意	設定されていない
3. 用法及び用量	(1) 用法及び用量の解説 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。 (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠 該当資料なし
4. 用法及び用量に関連する注意	設定されていない
5. 臨床成績	(1) 臨床データパッケージ 該当しない (2) 臨床薬理試験 該当資料なし (3) 用量反応探索試験 該当資料なし (4) 検証的試験 1) 有効性検証試験 〔国内第Ⅲ相試験〕 <sup>4)</sup> アレルギー性結膜炎患者（262例）を対象に0.05%ケトチフェン点眼液（128例）又は2%クロモグリク酸ナトリウム点眼液（134例）を1回1～2滴、1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）、4週間点眼した二重盲検比較試験において、全般改善度は0.05%ケトチフェン点眼液群66%、2%クロモグリク酸ナトリウム点眼液群63%で両群間に有意差は認められなかった。また0.05%ケトチフェン点眼液投与群に副作用は認められなかった。 2) 安全性試験 該当資料なし (5) 患者・病態別試験 該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物 又は化合物群

エピナスチン塩酸塩、レボカバスチン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩等のヒスタミン<sub>H<sub>1</sub></sub>受容体拮抗薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

作用部位：眼組織

作用機序<sup>5,6)</sup>：肥満細胞からのメディエーター遊離を抑制し、ヒスタミン<sub>H<sub>1</sub></sub>受容体への結合を遮断することで抗アレルギー作用及び抗ヒスタミン作用を示す。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

[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）<sup>5)</sup>。

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*）<sup>5,7,8)</sup>。

また、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<sup>9)</sup>、ヒヒ<sup>10)</sup>）。

[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<sup>5)</sup>。

[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Compound 48/80誘発結膜炎を抑制する（ラット、点眼）<sup>11)</sup>。

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）<sup>12)</sup>。

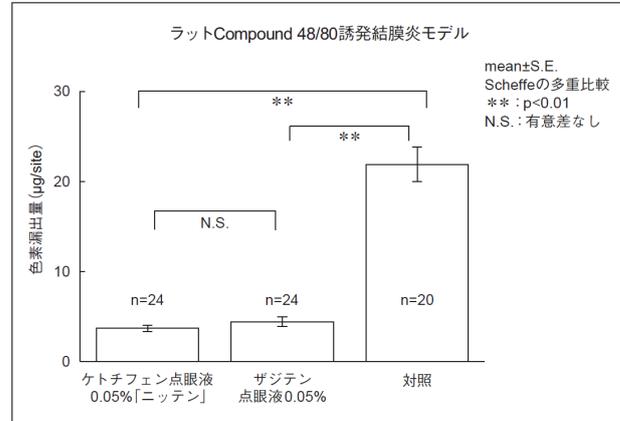
[生物学的同等性試験]

#### 1) ラットCompound 48/80誘発結膜炎モデルに対する効果<sup>13)</sup>

ラットに1%エバンスブルー・生理食塩液溶液を尾静脈内注射し、同時に両眼の上眼瞼結膜下にCompound 48/80・生理食塩液溶液を注射して結膜炎を惹起した。各試験薬剤は炎症惹起の20分前及び10分前に10 $\mu$ Lずつ点眼した。炎症惹起30分後に屠殺し、眼瞼結膜の色素漏出部分を切り取り、一夜色素を抽出した。色素抽出液をろ過し、分光光度計にて吸光度（波長：625nm）を測定し、検量線より色素漏出量を算出した。

各群の色素漏出量をグラフに示した。

色素漏出量において、ケトチフェン点眼液0.05%「ニッテン」及びザジテン点眼液0.05%は対照（生理食塩液）との間に有意差を認め（ $p < 0.01$ ）、ケトチフェン点眼液0.05%「ニッテン」とザジテン点眼液0.05%の間に有意差は認められず、生物学的に同等であると判断された。（Scheffeの多重比較）

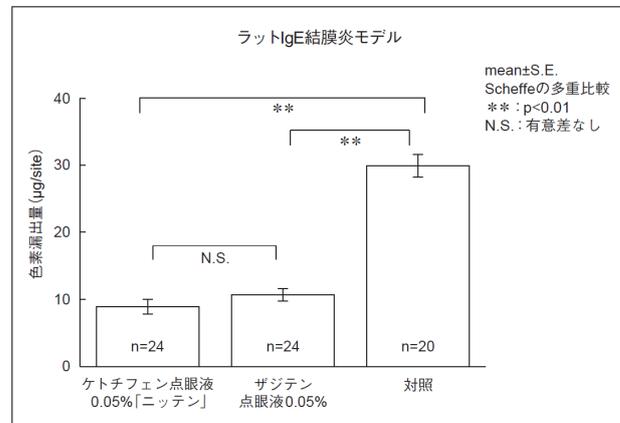


## 2) ラット IgE 結膜炎モデルに対する効果<sup>14)</sup>

抗卵白アルブミン (EA) ラット血清を生理食塩液で希釈し、ラット両眼の上眼瞼結膜下に注射して受動感作した。72時間後に1% EA・生理食塩液溶液と1%エバンスブルー・生理食塩液溶液の等量混合液を尾静脈内注射して結膜局所にアレルギー反応を惹起した。各試験薬剤の点眼は、炎症惹起の20分前及び10分前に10 µLずつ行った。炎症惹起の30分後に屠殺し、眼瞼結膜の色素漏出部分を切り取り、一夜色素を抽出した。色素抽出液をろ過し、分光光度計にて吸光度（波長：625nm）を測定し、検量線より色素漏出量を算出した。

各群の色素漏出量をグラフに示した。

色素漏出量において、ケトチフェン点眼液0.05%「ニッテン」及びザジテン点眼液0.05%は対照（生理食塩液）との間に有意差を認め（ $p < 0.01$ ）、ケトチフェン点眼液0.05%「ニッテン」とザジテン点眼液0.05%の間に有意差は認められず、生物学的に同等であると判断された。（Scheffeの多重比較）



## (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>15)</sup>

<sup>14</sup>C-ケトチフェンフマル酸塩の点眼液 (9.67mg/0.195mCi/mL)

50 $\mu$ Lをウサギに1回投与したとき、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漿中ケトチフェンフマル酸塩濃度は、結膜中の濃度の1/70程度と予測された。

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (3) 消失速度定数

該当資料なし

#### (4) クリアランス

該当資料なし

#### (5) 分布容積

該当資料なし

#### (6) その他

該当資料なし

### 3. 母集団(ポピュレーション) 解析

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) パラメータ変動要因

該当資料なし

### 4. 吸収

該当資料なし

## 5. 分布

### (1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

### (2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

### (3) 乳汁への移行性

該当資料なし

### (4) 髄液への移行性

該当資料なし

### (5) その他の組織への移行性

<sup>14</sup>C-ケトチフェンフマル酸塩の点眼液 (9.67mg/0.195mCi/mL) 50 μLをウサギに1回投与し、眼組織への移行性を検討した。眼組織における <sup>14</sup>C-ケトチフェンフマル酸塩の濃度は投与後 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<sup>15)</sup>。

### (6) 血漿蛋白結合率<sup>2)</sup>

ケトチフェンの蛋白結合率は約75% (*in vitro*、ヒト血清、平衡透析法) (経口投与時)

## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路<sup>2)</sup>

(外国人) : 血中及び尿中主代謝産物はグルクロン酸抱合体で、脱メチル化体及びN-酸化体はわずか (経口投与時)

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

該当資料なし

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合<sup>1)</sup>

肝初回通過効果を受け、胆汁中に排泄されて、腸肝循環する。(経口投与時)

### (4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

## 7. 排泄

健康成人に<sup>14</sup>C-ケトチフェン投与時の排泄率は尿中71.1%、糞中26.4% (外国人、120時間値) (経口投与時)<sup>2)</sup>

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者 該当資料なし

11. その他 該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する  
注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する  
注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその  
理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に  
関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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。

(6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

設定されていない

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

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

注) 発現頻度は使用成績調査を含む

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- ・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こと。
- ・患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
- ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。
- ・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<sup>16)</sup>。

12. その他の注意

- (1) 臨床使用に基づく情報  
設定されていない
- (2) 非臨床試験に基づく情報  
設定されていない

## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験  
「VI. 薬効薬理に関する項目」を参照すること
- (2) 安全性薬理試験  
該当資料なし
- (3) その他の薬理試験  
該当資料なし

### 2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験  
該当資料なし
- (2) 反復投与毒性試験  
該当資料なし
- (3) 遺伝毒性試験  
該当資料なし
- (4) がん原性試験  
該当資料なし
- (5) 生殖発生毒性試験  
該当資料なし
- (6) 局所刺激性試験  
眼刺激性試験<sup>17)</sup>  
白色家兎にケトチフェン点眼液0.05%「ニッテン」を1回1滴(約50 $\mu$ L)、1日4回、1週間反復点眼した試験において、前眼部、前房内及び角膜上皮等に異常はみられず、眼粘膜に対する刺激性並びに障害性はないと考えられた。
- (7) その他の特殊毒性  
該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	製 剤：該当しない 有効成分：毒薬
2. 有効期間	有効期間：3年
3. 包装状態での貯法	室温保存
4. 取扱い上の注意	設定されていない
5. 患者向け資材	患者向医薬品ガイド：無 くすりのしおり：有 その他の患者向け資材：無
6. 同一成分・同効薬	同一成分：ザジテン点眼液0.05%（ノバルティスファーマ） ケトチフェンPF点眼液0.05%「日点」（ロートニッテン） 同 効 薬：クロモグリク酸ナトリウム(DSCG)、ペミロラストカリウ ム、トラニラスト、アシタザノラスト水和物、レボカバ スチン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩など
7. 国際誕生年月日	1977年10月15日
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	製造販売承認年月日：2018年12月28日（販売名変更による） 承認番号：23000AMX00897000 薬価基準収載年月日：2019年6月14日（販売名変更による） 販 売 開 始 年 月：1999年7月12日 [注] 旧販売名：フマルトン点眼液 承認年月日：1998年12月22日 経過措置期間終了：2009年3月31日 [注] 旧販売名：フマルトン点眼液0.05% 承認年月日：2008年3月13日 経過措置期間終了：2020年3月31日
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	該当しない

10. 再審査結果、再評価結果  
公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名：ケトチフェン点眼液 0.05% 「ニッテン」

厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT(9 桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
1319730Q1389	1319730Q1389	102232201	620223201

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

## X I . 文 献

### 1. 引用文献

- 1) 第十八改正日本薬局方解説書, 2021 (廣川書店)
- 2) 日本薬局方医薬品情報 (JPDI) 2021 (じほう)
- 3) ロートニッテンファーマ株式会社 社内資料 [安定性試験]
- 4) 三国郁夫 他: 臨床評価. 1989 ; 17(2) : 275-297
- 5) Martin U, et al. : Arzneimittelforschung. 1978 ; 28(5) : 770-782
- 6) 高折修二 他: グッドマン・ギルマン薬理書 第12版. 廣川書店. 2013 : 1171-1179
- 7) 熊谷朗 他: メディカルサンド. 1980 ; 8(2) : 87-93
- 8) 岸本真知子 他: アレルギーの臨床. 1984 ; 4(2) : 149-151
- 9) Morley J, et al. : Agents Actions Suppl. 1988 ; 23 : 187-194
- 10) Arnoux B, et al. : Am Rev Respir Dis. 1988 ; 137(4) : 855-860
- 11) 山口武 他: 医薬品研究. 1989 ; 20(1) : 48-56
- 12) 石崎道治: アレルギー. 1986 ; 35(12) : 1149-1157
- 13) ロートニッテンファーマ株式会社 社内資料 [生物学的同等性試験Ⅰ]
- 14) ロートニッテンファーマ株式会社 社内資料 [生物学的同等性試験Ⅱ]
- 15) 太田真一 他: 臨床医薬. 1988 ; 4(11) : 2183-2191
- 16) Christensen MT, et al. : CLAO J. 1998 ; 24(4) : 227-231
- 17) ロートニッテンファーマ株式会社 社内資料 [眼刺激性試験]

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況 該当しない

2. 海外における臨床支援情報 該当しない

### XⅢ. 備考

- |                                         |                                                      |
|-----------------------------------------|------------------------------------------------------|
| 1. 調剤・服薬支援に際して<br>臨床判断を行うに<br>あたっての参考情報 | (1) 粉碎<br>該当しない<br>(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性<br>該当しない |
| 2. その他の関連資料                             | 該当資料なし                                               |

N00411