

日本標準商品分類番号	871319
------------	--------

抗アレルギー一点眼剤

貯法	室温保存 「取扱い上の注意」参照
使用期限	包装に表示の使用期限内 に使用すること

ザジテン®点眼液 UD 0.05%

Zaditen® ophthalmic solution UD 0.05%

承認番号	21600AMY00063000
薬価基準収載年月	2004年7月
販売開始年月	2004年10月

*(ケトチフェンフマル酸塩点眼液)

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

品名	ザジテン®点眼液 UD0.05%
成分・含量	1 mL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）
添加物	グリセリン、水酸化ナトリウム
性状	無色～微黄色澄明の無菌に製した水性 点眼液で、においはないか、又はわず かに特異なおいがある。
pH	4.8～5.8
浸透圧比 (生理食塩液に対する比)	0.7～1.0

【効能・効果】

アレルギー性結膜炎

【用法・用量】

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。

【使用上の注意】

*** 1. 副作用**

本剤の臨床試験等は実施していないので、ベンザルコニ
ウム塩化物を含有するザジテン®点眼液0.05%での成績
を以下にあげる。

総症例6,557例中、副作用が認められたのは220例
(3.36%)であった。主な副作用はしみる・眼刺激171件
(2.61%)、眼瞼炎18件(0.27%)、眠気18件(0.27%)等
であった。（再審査終了時までの集計）

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

副作用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。

2. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

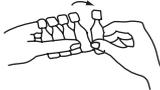
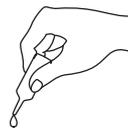
妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には治療上の有
益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与する
こと。

〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

3. 適用上の注意

- (1) 投与経路：点眼用にのみ使用すること。
- (2) 投与时：
 - 1) 点眼のとき、容器の先端が直接目に触れない
よう注意するよう指導すること。
 - 2) 使用の際は、最初の1～2滴は点眼せずに捨
てるよう指導すること。
 - 3) 二次汚染防止の保存剤を含有しない、1回使
い捨ての無菌ディスポーザブルタイプの製剤
であるので、使用後の残液は廃棄するよう指
導すること。
 - 4) 点眼した時に液が眼瞼皮膚等についた場合は、
すぐにふき取るよう指導すること。

(3) 使用方法：

<p>1</p>  <p>1本の容器を切り離す。残 りは、再びアルミ袋に戻して 開封口を折り曲げて閉じる。</p>	<p>2</p>  <p>容器上部の平らな部分をね じ切る。</p>
<p>3</p>  <p>点眼する前に、1～2滴捨 てる。</p>	<p>4</p>  <p>両眼に1～2滴ずつ、容器 先端部が直接、目に触れな いように点眼する。使用後は 残液を廃棄する。</p>

【薬物動態】

(参考：動物)

眼組織内移行¹⁾

¹⁴C-ケトチフェンフマル酸塩をウサギに1回点眼投与し、眼
組織及び血中への移行性を検討した。

眼組織における濃度は投与後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。

点眼投与によっても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中濃度は、結膜中の濃度の1/70程度と予測された。

【臨床成績】^{2~4)}

本剤の臨床試験等は実施していないので、ベンザルコニウム塩化物を含有するザジテン[®]点眼液0.05%での成績を以下にあげる。

二重盲検比較試験を含むアレルギー性結膜炎における臨床試験成績の概要は次のとおりである。

臨床効果判定は、自覚症状（そう痒感、流涙等）及び他覚所見（充血、浮腫等）を調査して行った。有効率は69.1%（192/278）であった。また、二重盲検比較試験において有用性が確認された。

【薬効薬理】

1. 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）⁵⁾。

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*）^{5~7)}。

また、抗原及び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⁸⁾、ヒヒ⁹⁾）。

2. 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⁵⁾。

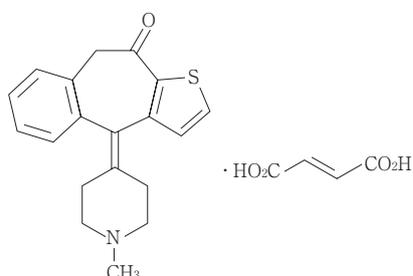
3. 動物結膜炎モデルにおける作用

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Compound48/80誘発結膜炎を抑制する（ラット、点眼）¹⁰⁾。

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）¹¹⁾。

【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：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）

分配係数：0.7（1-オクタノール/0.1mol/L塩酸）

【取扱い上の注意】

1. 保険給付上の注意

本剤は「アレルギー性結膜炎」患者のうち、「ベンザルコニウム塩化物に対し過敏症の患者又はその疑いのある患者」に保険給付が限定される。

2. 保存上の注意

アルミ袋開封後、未使用の容器は、アルミ袋に戻して開封口を折り曲げて閉じ、1ヵ月以内に使用すること。

【包装】

ザジテン[®]点眼液 UD0.05% 0.4mL×100本（5本×20）

【主要文献】

- 1) 太田真一ほか：臨床医薬 4(11), 2183, 1988 [ZENJ00850]
- 2) 三国郁夫ほか：臨床医薬 4(12), 2371, 1988 [ZENJ00847]
- 3) 藤田善史ほか：臨床医薬 5(4), 709, 1989 [ZENJ00923]
- 4) 石崎道治ほか：Prog. Med. 9(5), 1625, 1989 [ZENJ00932]
- 5) Martin, U. et al. : Arzneimittel-Forsch. Drug Res. 28(5), 770, 1978 [ZENM00019]
- 6) 熊谷 朗ほか：メディカルサント 8(2), 87, 1980 [ZENJ00016]
- 7) 岸本真知子ほか：アレルギーの臨床 4(2), 149, 1984 [ZENJ00110]
- 8) Morley, J. et al. : Agents. Actions. Suppl. 23, 187, 1988 [ZENM01112]
- 9) Arnoux, B. et al. : Am. Rev. Respir. Dis. 137(4), 855, 1988 [ZENM00894]
- 10) 山口 武ほか：医薬品研究 20(1), 48, 1989 [ZENJ00900]
- 11) 石崎道治：アレルギー 35(12), 1149, 1986 [ZENJ00492]

**【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

日本アルコン株式会社 メディカル統括部 学術情報部

〒107-0052 東京都港区赤坂2-17-7

電話 03-3588-3221

FAX 03-3588-3229

受付時間 9：00～17：30（土、日、祝日、社休日を除く）

【輸入品】

**製造販売元（輸入元）
Alcon 日本アルコン株式会社
JAPAN 東京都港区赤坂2-17-7

©2012 Novartis

ZAD 12.04I-2-1DK