

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2008 に準拠して作成

アレルギー性疾患治療剤

マゴチフェン[®]カプセル 1mg

マゴチフェン[®]ドライシロップ 0.1%

MAGOTIPHEN Capsules 1mg

MAGOTIPHEN Dry Syrup 0.1%

剤形	カプセル剤	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
	ドライシロップ剤	白色のシロップ剤
製剤の規制区分	該当しない	
規格・含量	カプセル剤	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)
	ドライシロップ剤	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)
一般名	和名：ケトチフェンフマル酸塩 洋名：Ketotifen Fumarate	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	カプセル剤	製造販売承認年月日：2008年7月29日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2008年12月19日（販売名変更による） 販売年月日：1992年7月10日
	ドライシロップ剤	製造販売承認年月日：2008年9月4日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2008年12月19日（販売名変更による） 販売年月日：1992年7月10日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：鶴原製薬株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	鶴原製薬株式会社 医薬情報部 TEL：072-761-1456（代表） FAX：072-760-5252 医療関係者向けホームページ http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/	

本 I F は 2012 年 2 月 改訂（第 12 版）の添付文書の記載に基づき改訂した。最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ <http://www.info.pmda.go.jp/> にてご確認下さい。

I F 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過した現在、薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会において新たなIF記載要領が策定された。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとす。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

[IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「IF 記載要領 2008」により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」（以下、「IF記載要領2008」と略す）は、平成21年4月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2008年9月)

目 次

[I] 概要に関する項目	1
[II] 名称に関する項目	2
[III] 有効成分に関する項目	3
[IV] 製剤に関する項目	4
[V] 治療に関する項目	17
[VI] 薬効薬理に関する項目	19
[VII] 薬物動態に関する項目	20
[VIII] 安全性(使用上の注意等)に関する項目	26
[IX] 非臨床試験に関する項目	29
[X] 管理的事項に関する項目	30
[X I] 文 献	33
[X II] 参考資料	33
[X III] 備 考	33

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

マゴチフェンカプセル 1mg は、鶴原製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、1990年9月12日に承認を取得、1992年7月10日に上市した。その後、医療過誤防止のため、2008年7月29日に製品名を「マゴチフェンカプセル」から「マゴチフェンカプセル 1mg」に変更の承認を得て、2008年12月19日より販売の運びとなった。

マゴチフェンドライシロップ 0.1%は、鶴原製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、1991年11月29日に承認を取得、1992年7月10日に上市した。その後、医療過誤防止のため、2008年9月4日に製品名を「マゴチフェンドライシロップ」から「マゴチフェンドライシロップ 0.1%」に変更の承認を得て、2008年12月19日より販売の運びとなった。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

マゴチフェンカプセル 1mg 及びマゴチフェンドライシロップ 0.1%の有効成分であるケトチフェンフマル酸塩は、アレルギー反応に関与するヒスタミンやSRSAの遊離を抑制するとともに、これらケミカルメディエーターの作用に対しても抑制を示す。臨床的にはアナフィラキシー（アレルギー）反応に関与する気管支喘息、鼻炎や皮膚障害に対して効果が認められている。

Ⅱ. 名称に関する項目

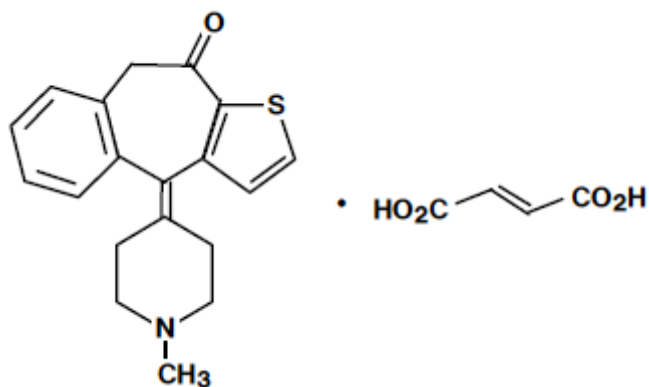
1. 販売名

- 1) 和名
マゴチフェン カプセル 1mg
マゴチフェン ドライシロップ 0.1%
- 2) 洋名
MAGOTIPHEN Capsules 1mg
MAGOTIPHEN Dry Syrup 0.1%
- 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
- 2) 洋名（命名法）：Ketotifen Fumarate
- 3) ステム：不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量



5. 化学名（命名法）

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

6. 慣用名，別名，略号，記号番号

特になし

7. CAS登録番号

34580-14-8

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

1) 外観・性状

白色～淡黄白色の結晶性の粉末である。

2) 溶解性

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。

3) 吸湿性

該当資料なし

4) 融点（分解点），沸点，凝固点

融点：約 190℃（分解）

5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

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

(1) 硫酸塩の定性反応

(2) 紫外可視吸光度測定法

(3) 赤外吸収スペクトル測定法

4. 有効成分の定量法

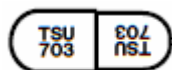
電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別及び性状

〈カプセル〉：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

〈ドライシロップ〉：白色のシロップ剤で芳香を有する。味は甘い。

2) 製剤の物性：該当資料なし

3) 識別コード：

〈カプセル〉：TSU703

4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等：該当資料なし

2. 製剤の組成

1) 有効成分（活性成分）の含量

〈カプセル〉：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）

〈ドライシロップ〉：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）

2) 添加物

〈カプセル〉：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

〈ドライシロップ〉：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

3) その他

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当資料なし

4. 製剤の各種条件下における安定性

マゴチフェンカプセル 1mg

試験条件及び保管		試験期間	保存包装	試験項目
室温 保存 試験	(1) 温度 16～32.5° 湿度 35～99%RH 試験保存室の棚におく	6ヶ月	①ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装する。 ②PTP包装し、紙箱に入れる。	(1)性状 (2)確認試験 (3)崩壊試験 (4)重量偏差試験 (5)含量均一性試験 (6)定量 (7)分解物の有無
加速 試験	(2) 温度 40° 湿度 75%RH ※	6ヶ月	①ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装する。 ②PTP包装し、紙箱に入れる。	(1)性状 (2)確認試験 (3)崩壊試験 (4)重量偏差試験 (5)含量均一性試験 (6)定量 (7)分解物の有無
苛酷 試験	(3) 2000ルクスの光を照射する	1ヶ月	カプセルをシャーレに入れる。	(1)性状 (2)確認試験 (3)崩壊試験 (4)重量偏差試験 (5)含量均一性試験 (6)定量 (7)分解物の有無

(1)性状

室温・40° 75%・曝光いずれの条件においても着色、着香、吸湿などの変化はなかった。

(2)確認試験

いずれの条件においても規格に適合した。

(3)崩壊試験

いずれの条件でも変化は認められなかった。

(4)重量偏差試験、含量均一試験

室内及び40° 75%の6ヶ月、曝光1ヶ月経過後の検体について本試験においていずれの包装形態においてもほとんど変化はなく、規格に適合した。

(5)定量

いずれの条件でもほとんど含量の低下は認められなかった。

(6)分解物

TLC法により分解物を検討したがいずれも認められなかった。

結果

加速試験の結果より本品はその包装形態で、熱、湿度の影響はほとんどうけず安定であった。又、光の影響もほとんどうけていないと考えられる。よって、マゴチフェンカプセル 1mg は室温 3 年間は安定な薬剤であると考えられる。

又、貯法を先発品を参考に室温保存とした。

ロット番号 301MC

保存条件	包装	経過 日数	性状			確認試験			重量偏差試験			崩壊試験 (分)			含量均一性試験 (%)			定量 (%)				
			1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	平均	
室温	ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	製造時	白色粉末の 入った 白色不透明の硬 カプセル剤	白色粉末の 入った 白色不透明の硬 カプセル剤	白色粉末の 入った 白色不透明の硬 カプセル剤	(1)適 (2)適 (3)適 (4)適	(1)適 (2)適 (3)適 (4)適	(1)適 (2)適 (3)適 (4)適	平均重量(mg) 偏差(%) 175.9 -3.1~1.8	平均重量(mg) 偏差(%) 174.8 -0.8~2.4	平均重量(mg) 偏差(%) 175.4 -1.7~2.6	1.6~2.3	1.5~2.5	1.8~2.5	平均含量(mg) 偏差(%) 99.6 -3.4~5.5	平均含量(mg) 偏差(%) 99.6 -3.2~6.2	平均含量(mg) 偏差(%) 100.4 -4.9~5.2	99.6	99.6	100.4	99.9	
		1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.8~2.0	1.6~2.3	1.5~2.4				99.9	99.7	99.7	99.8	
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.9~2.1	1.7~2.4	1.8~2.0				100.2	100.2	99.5	100.0	
		6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	175.0 -0.4~1.7	175.9 -0.3~2.3	174.9 -2.3~2.5	1.7~1.9	1.8~2.1	1.6~1.9	100.3 -3.2~6.2	98.2 -3.7~6.1	99.9 -3.7~5.5	100.3	98.2	99.9	99.5	
	PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.7~2.1	1.6~2.3	1.5~2.5				100.6	97.0	99.2	98.9	
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.5~2.0	1.7~2.1	1.8~2.2				98.6	100.3	99.6	99.5	
		6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	174.1 -2.5~1.5	175.0 -2.5~1.9	175.9 -3.4~2.3	1.9~2.4	1.7~2.2	1.6~1.9	100.0 -6.3~3.2	100.0 -5.8~4.4	99.4 -6.1~4.6	100.0	100.0	99.4	99.8	
	40℃75%RH	ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.6~2.3	1.9~2.4	1.7~2.1				101.9	101.0	98.1	100.3
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.5~2.2	1.7~2.5	1.6~2.3				100.3	99.6	100.8	100.2
			6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	175.6 -3.0~2.6	176.0 -3.1~2.8	174.2 -3.2~2.5	1.8~2.2	1.7~2.3	1.6~2.4	99.9 -1.7~5.6	101.5 -5.1~5.4	100.2 -2.7~4.1	99.9	101.5	100.2	100.5
		PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.5~1.9	1.7~2.1	1.5~2.3				99.3	100.7	100.8	100.3
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.7~2.0	1.5~2.0	1.6~1.9				100.1	99.7	100.0	99.9
6ヶ月			同上	同上	同上	同上	同上	同上	175.4 -2.8~2.5	175.3 -2.7~1.7	176.3 -1.6~0.7	1.5~2.4	1.7~2.5	1.8~2.2	99.7 -6.8~3.4	100.1 -6.8~4.3	100.7 -4.0~5.8	100.2	100.3	100.5	100.3	
過酷試験	カプセルをシャーレに入れ光を照射する	2週間	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.6~2.4	1.7~2.3	1.5~2.0				100.3	99.8	99.0	99.7	
		1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	176.3 -1.0~1.5	173.7 -1.9~2.7	175.4 -1.9~2.5	1.8~2.5	1.7~2.0	1.6~2.1	100.9 -6.2~3.5	100.3 -5.7~3.3	99.3 -5.6~5.2	100.9	100.3	99.8	100.3	

ロット番号 302MC

保存条件	包装	経過 日数	性状			確認試験			重量偏差試験			崩壊試験 (分)			含量均一性試験 (%)			定量 (%)				
			1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	平均	
室温	ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	製造時	白色粉末の 入った 白色不透明の硬 カプセル剤	白色粉末の 入った 白色不透明の硬 カプセル剤	白色粉末の 入った 白色不透明の硬 カプセル剤	(1)適 (2)適 (3)適 (4)適	(1)適 (2)適 (3)適 (4)適	(1)適 (2)適 (3)適 (4)適	平均重量(mg) 偏差(%) 174.7 -2.3~1.8	平均重量(mg) 偏差(%) 175.9 -3.3~1.8	平均重量(mg) 偏差(%) 174.9 -1.2~2.1	1.5~2.3	1.6~2.4	1.5~2.5	平均含量(mg) 偏差(%) 100.2 -4.9~5.6	平均含量(mg) 偏差(%) 100.0 -5.8~6.5	平均含量(mg) 偏差(%) 100.2 -4.0~3.4	100.2	100.0	100.2	100.1	
		1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.8~2.0	1.5~2.2	1.6~2.1				100.4	100.9	98.6	100.0	
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.7~2.0	1.6~2.3	1.5~2.3				99.3	100.7	100.9	100.3	
		6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	175.3 -1.0~1.4	175.5 -1.6~2.1	175.1 -1.3~1.8	1.6~1.9	1.5~1.9	1.8~2.4	99.5 -6.4~5.2	100.5 -5.6~6.2	98.0 -3.7~4.3	99.5	100.5	98.0	99.3	
	PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.6~2.2	1.8~2.4	1.6~2.3				100.8	100.1	100.5	100.5	
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.5~2.0	1.7~2.3	1.6~2.3				100.1	99.2	100.9	100.1	
		6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	174.8 -1.5~1.4	175.6 -1.6~1.8	175.9 -3.1~1.7	1.8~2.2	1.9~2.5	2.0~2.3	98.5 -5.3~2.4	99.3 -5.7~6.0	100.2 -4.9~3.1	99.5	99.3	100.2	99.7	
	40℃75%RH	ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.7~2.3	1.5~2.4	1.7~2.5				99.9	100.0	100.6	100.2
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.8~2.0	1.6~1.9	1.5~2.2				98.3	99.2	100.0	99.2
			6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	175.9 -3.1~2.5	175.2 -1.8~2.0	174.5 -2.1~0.4	1.6~2.1	1.8~2.3	1.5~2.0	99.1 -4.7~3.9	99.7 -6.1~5.4	99.5 -5.8~4.1	99.7	99.7	99.5	99.6
		PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.6~2.4	1.7~2.1	1.8~2.4				99.4	100.6	100.5	100.2
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.5~2.3	1.9~2.5	1.7~2.3				99.1	99.9	99.6	99.5
6ヶ月			同上	同上	同上	同上	同上	同上	175.6 -1.5~2.0	174.9 -1.1~1.2	176.5 -3.3~1.4	1.7~2.4	1.6~2.5	1.9~2.4	99.9 -0.6~2.4	100.1 -5.2~4.1	100.0 -6.4~5.1	99.7	100.1	100.7	100.2	
過酷試験	カプセルをシャーレに入れ光を照射する	2週間	同上	同上	同上	同上	同上	同上				1.8~2.4	1.6~2.3	1.7~2.0				99.3	99.9	99.6	99.6	
		1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	173.9 -1.7~1.8	176.5 -0.8~2.7	175.5 -2.7~2.5	1.6~2.3	1.5~2.1	1.7~2.4	100.7 -5.6~4.2	101.0 -1.9~1.9	99.9 -3.0~6.2	100.7	101.0	99.9	100.5	

ロット番号 303MC

	保存条件	包装	経過 日数	性状			確認試験			重量偏差試験			崩壊試験 (分)			含量均一性試験 (%)			定量 (%)				
				1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	平均	
加速試験	室温	ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	製造時	白色粉末の 入った 白色不透明の硬 カプセル剤	白色粉末の 入った 白色不透明の硬 カプセル剤	白色粉末の 入った 白色不透明の硬 カプセル剤	(1)適 (2)適 (3)適 (4)適	(1)適 (2)適 (3)適 (4)適	(1)適 (2)適 (3)適 (4)適	平均重量(mg) 偏差(%) 175.5 -1.1~1.9	平均重量(mg) 偏差(%) 174.7 -1.2~2.3	平均重量(mg) 偏差(%) 175.7 -2.6~1.5	1.6~2.3	1.5~2.2	1.6~2.5	平均含量(mg) 偏差(%) 100.4 -1.5~5.2	平均含量(mg) 偏差(%) 99.4 -4.7~1.9	平均含量(mg) 偏差(%) 100.4 -3.9~6.5	100.4	99.9	100.4	100.2	
			1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	1.6~2.3	1.7~2.1	1.8~2.3	同上	同上	同上	99.3	100.5	99.7	99.8
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	1.8~2.4	1.8~2.5	1.7~2.4	同上	同上	同上	98.3	99.6	99.9	99.3
			6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	174.1 -1.1~2.7	175.7 -2.6~1.9	176.6 -2.2~1.4	1.5~2.3	1.6~2.0	1.7~2.2	100.1 -4.9~2.6	100.1 -4.8~5.6	101.6 -3.8~6.1	100.1	100.1	101.6	100.6
		PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	1.7~2.4	1.8~2.3	1.5~1.9	同上	同上	同上	100.8	100.8	100.5	100.7
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	1.5~2.0	1.6~2.4	1.7~2.2	同上	同上	同上	100.7	100.9	99.0	100.2
	40°C75%RH	ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	1.6~2.3	1.8~2.1	1.7~2.3	同上	同上	同上	99.0	98.9	99.2	99.0
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	1.5~1.2	1.7~2.3	1.7~2.3	同上	同上	同上	98.9	101.6	100.9	100.5
			6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	175.3 -3.0~2.5	174.6 -0.3~2.3	175.4 -2.6~1.8	1.9~2.4	2.0~2.4	1.7~2.2	101.0 -3.9~5.2	99.4 -4.2~5.1	100.4 -4.1~3.0	101.0	99.4	100.4	100.3
		PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	1.6~2.0	1.6~2.1	1.7~2.3	同上	同上	同上	98.8	99.1	101.3	99.7
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	1.7~2.1	1.6~2.1	1.8~2.4	同上	同上	同上	98.4	99.0	100.5	99.3
			6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	175.8 -3.5~1.2	174.2 -2.6~2.4	175.6 -1.3~0.8	1.7~2.1	1.8~2.2	1.6~2.3	100.2 -4.6~5.1	100.3 -4.1~4.6	100.5 -3.4~2.8	99.9	100.1	100.0	100.0
過酷試験	カプセルをシャーレに入れ光を照射する	2週間	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	1.6~2.3	1.7~2.3	1.7~2.3	同上	同上	同上	99.9	99.8	100.1	99.9		
		1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	174.6 -1.5~1.1	175.8 -1.7~1.4	174.9 -2.6~1.8	1.5~2.2	1.7~2.3	1.5~1.9	99.3 -2.9~3.5	99.3 -3.3~5.2	98.8 -4.0~6.5	99.3	99.3	98.8	99.1	

マゴチフェンドライシロップ 0.1%

試験条件及び保管		試験期間	保存包装	試験項目
室温 保存 試験	(1) 温度 8.5～32° 湿度 31～98%RH 試験保存室の棚におく	6ヶ月	①ポリエチレン袋に入れブリキ缶に入れる。 ②分包包装し、紙箱に入れる。	(1)性状 (2)確認試験 (3)※2重量偏差試験 (4)※2粒度試験 (5)定量
加 速 試 験	(2) 温度 40° 湿度 75%RH ※1	6ヶ月	①ポリエチレン袋に入れブリキ缶に入れる。 ②分包包装し、紙箱に入れる。	(1)性状 (2)確認試験 (3)※2重量偏差試験 (4)※2粒度試験 (5)定量
苛 酷 試 験	(3) 曝光下 20Wの蛍光灯を30cmの距離から照射する。 (2000ルクス)	1ヶ月	散剤をシャーレに入れ光を照射する。	(1)性状 (2)確認試験 (3)※2粒度試験 (4)定量

※1 タバイ製作所 (HUMIDITY CABINET THL-Ⅲ) 自記記録計つき恒温恒湿機中に入れる。

※2 重量偏差試験及び粒度試験については加速試験では製造時と6ヶ月目、苛酷試験では粒度試験については1ヶ月目にのみ行う。

(1)性状

室温・40° 75%RH・曝光いずれの条件においても着色、着香、吸湿などの変化はなかった。

(2)確認試験

いずれの条件においても規格に適合した。

(3)重量偏差試験

0.4g、0.6g、1.0gのいずれの条件でも変化は認められなかった。

(4)粒度試験

いずれの条件でも変化は認められなかった。

(5)定量

いずれの条件でもほとんど含量の低下は認められなかった。

なお、定量時の液クロチャートより保存剤であるパラオキシ安息香酸メチル及びパラオキシ安息香酸プロピルの量は変化がないと考えられる。又、特に分解物等の異常ピークは認められなかった。

結果

以上の結果より本品はその包装形態で、熱、湿度の影響はほとんどうけず安定であった。又、光の影響もほとんどうけていないと考えられる。

よって、本品は室温3年間は安定な薬剤であると考えられる。

ロット番号 901MD S

保存条件	包装	経過 日数	性状			確認試験			重量偏差試験			粒度試験 (注)						定量 液体クロマトグラフ法 (%)				定量 吸光光度法 (%)								
			1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回		2回		3回		1回	2回	3回	平均	1回	2回	3回	平均					
			平均重量(mg) 偏差 (%)	平均重量(mg) 偏差 (%)	平均重量(mg) 偏差 (%)	a	b	c	a	b	c	a	b	c	1回	2回	3回	平均	1回	2回	3回	平均								
加速試験	室温	製造時	白色散剤 で芳香を 有し、味は 甘い	白色散剤 で芳香を 有し、味は 甘い	白色散剤 で芳香を 有し、味は 甘い	(1)適 (2)適	(1)適 (2)適	(1)適 (2)適	404.4 -1.1~5	411.3 -1.0~3.0	404.6 -1.9~3.6	0	1.3	8.5	0	0.8	9.8	0	1.1	7.5	97.8	98.1	97.7	97.9	98.8	99.5	97.5	98.6		
		ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上													97.1	98.2	98.2	97.8	95.7	98.0	98.0	97.8	
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上													99.2	96.5	98.2	98.0	97.6	97.8	98.1	97.8	
	6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上				0	2.0	7.0	0	1.0	7.0	0	3.0	6.0	97.0	96.6	98.0	97.2	97.7	98.2	97.4	97.8		
	PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上													98.1	98.0	96.4	97.5	97.4	96.0	97.8	97.1	
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上													97.5	98.1	98.8	98.1	98.5	97.3	98.0	97.9	
		6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	406.0 -0.9~2.1	418.8 -1.3~3.0	401.8 -0.6~2.0	0	3.0	5.0	0	2.0	9.0	0	2.0	5.0	98.9	99.1	98.2	98.7	97.6	97.8	97.5	97.6	
	40℃75%RH	ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上													97.3	98.4	98.2	98.0	98.3	97.6	97.5	97.8	
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上													98.0	97.9	98.2	98.0	97.5	97.4	98.0	97.6
			6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上				0	3.0	6.0	0	4.0	5.0	0	1.0	9.0	99.6	98.4	98.8	98.9	97.8	96.6	97.4	97.3
		PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上													98.2	97.8	98.3	98.1	97.5	97.4	97.6	97.5
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上													98.3	97.6	98.1	98.0	97.6	97.1	98.0	97.6
6ヶ月			同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上	408.4 -1.8~4.8	411.3 -2.5~2.1	405.5 -1.3~1.5	0	4.0	8.0	0	6.0	6.0	0	4.0	5.0	97.2	97.6	98.3	97.7	96.5	96.6	97.3	96.8	
過酷試験	カプセルをシャーレに入れ光を照射する	2週間	同上	同上	同上	同上	同上	同上													98.1	97.6	98.5	98.1	97.2	97.6	97.5	97.4		
		1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上				0	4.0	6.0	0	3.0	7.0	0	4.0	3.0	98.5	98.4	98.0	98.3	97.4	97.5	97.7	97.5	

(注)a:18号ふるいに残留するもの (%) (日局規格 0%)

B:18号ふるいを通過し30号ふるいに残留するもの (%) (5%以下)

C:200号ふるいを通過するもの (%) (10%以下)

ロット番号 902MD S

保存条件	包装	経過 日数	性状			確認試験			重量偏差試験			粒度試験 (注)									定量 液体クロマトグラフ法 (%)				定量 吸光光度法 (%)					
			1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回			2回			3回			1回	2回	3回	平均	1回	2回	3回	平均		
			平均重量(mg) 偏差 (%)	平均重量(mg) 偏差 (%)	平均重量(mg) 偏差 (%)	a	b	c	a	b	c	a	b	c	a	b	c	a	b	c	1回	2回	3回	平均	1回	2回	3回	平均		
加速試験	室温	製造時	白色散剤 で芳香を 有し、味は 甘い	白色散剤 で芳香を 有し、味は 甘い	白色散剤 で芳香を 有し、味は 甘い	(1)適 (2)適	(1)適 (2)適	(1)適 (2)適	399.2 -1.9~3.7	412.1 -1.6~2.6	400.6 -1.0~3.9	0	1.2	8.6	0	1.0	8.8	0	0.9	8.0	98.4	100.4	99.9	99.6	99.6	100.9	99.5	100.0		
		ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上													101.1	100.6	100.9	100.9	99.8	100.8	100.6	100.4	
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上														99.6	100.5	99.8	100.0	101.0	100.6	100.5	100.7	
	6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上					0	2.0	8.0	0	3.0	7.0	0	2.0	5.0	99.9	99.5	99.5	99.6	99.9	100.5	100.8	100.4		
	PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上														102.8	102.5	101.4	102.2	101.1	102.0	100.0	101.0	
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上														100.5	99.5	99.8	99.9	99.6	100.4	100.5	100.2	
		6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	411.8 -1.9~1.8	406.5 -1.0~1.9	399.8 -1.1~4.6	0	4.0	6.0	0	4.0	5.0	0	2.0	8.0	100.1	100.3	100.6	100.3	100.6	100.0	99.8	100.1		
	40°C75%RH	ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上														100.6	101.2	99.8	100.5	100.0	99.5	99.8	99.8	
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上														99.9	99.9	100.2	100.0	101.2	98.7	99.6	99.8
			6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上					0	3.0	6.0	0	2.0	7.0	0	3.0	6.0	101.3	100.8	101.7	101.3	99.8	101.2	100.6	100.5
		PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上														100.4	101.2	100.8	100.8	100.5	99.9	100.4	100.3
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上														100.4	100.8	101.3	100.8	99.7	100.8	100.5	100.3
6ヶ月			同上	同上	同上	同上	同上	同上	409.2 -2.2~3.1	406.1 -1.4~3.4	404.7 -1.1~3.1	0	5.0	6.0	0	3.0	6.0	0	4.0	7.0	100.6	101.2	100.5	100.8	99.9	100.5	101.1	100.5		
過酷試験	カプセルをシャーレに入れ光を照射する	2週間	同上	同上	同上	同上	同上	同上													99.5	100.4	99.5	99.8	99.4	100.7	99.6	99.9		
		1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上					0	4.3	3.0	0	1.0	4.0	0	5.0	5.0	100.5	100.1	99.6	100.1	99.6	100.2	99.8	99.9	

(注)a:18号ふるいに残留するもの (%) (日局規格0%)

B:18号ふるいを通過し30号ふるいに残留するもの (%) (5%以下)

C:200号ふるいを通過するもの (%) (10%以下)

ロット番号 903MD S

保存条件	包装	経過 日数	性状			確認試験			重量偏差試験			粒度試験 (注)									定量 液体クロマトグラフ法 (%)				定量 吸光光度法 (%)					
			1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回			2回			3回			1回	2回	3回	平均	1回	2回	3回	平均		
加速試験	室温	製造時	白色散剤 で芳香を 有し、味は 甘い	白色散剤 で芳香を 有し、味は 甘い	白色散剤 で芳香を 有し、味は 甘い	(1)適 (2)適	(1)適 (2)適	(1)適 (2)適	平均重量(mg) 偏差(%) 407.5 -1.9~2.5	平均重量(mg) 偏差(%) 400.7 -1.7~3.4	平均重量(mg) 偏差(%) 407.2 -1.7~1.3	a 0	b 0.8	c 7.5	a 0	b 0.9	c 8.6	a 0	b 1.2	c 9.2	103.1	101.9	100.3	101.8	101.0	100.4	101.0	100.8		
		ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上													102.5	101.6	101.9	102.0	101.6	101.5	100.9	101.3	
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上													100.1	102.1	100.8	101.0	100.6	101.2	101.6	101.1	
	6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上				0	1.0	6.0	0	4.0	8.0	0	2.0	4.0	99.7	101.2	100.6	100.5	100.8	101.5	101.1	101.1		
	PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上													98.5	99.5	100.5	99.5	101.5	100.6	101.7	101.3		
		3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上													100.1	102.5	101.6	101.4	100.8	101.6	102.5	101.6		
		6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	405.4 -1.1~2.8	414.7 -0.9~1.7	401.8 -0.9~2.6	0	4.0	5.0	0	2.0	8.0	0	1.0	8.0	102.1	102.3	100.5	101.6	100.5	101.7	101.6	101.3		
	40°C75%RH	ポリエチレン袋に入れブリキ缶包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上													101.8	100.6	101.5	101.3	100.9	101.8	101.1	101.3	
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上												101.4	102.3	100.5	101.4	100.0	101.5	101.0	100.8	
			6ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上				0	4.0	5.0	0	1.0	8.0	0	1.0	9.0	99.9	102.8	101.3	101.3	101.4	101.7	100.6	101.2
		PTP包装し紙箱包装	1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上													101.1	102.5	101.3	101.6	102.0	101.1	101.4	101.5
			3ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上	同上													100.6	102.1	101.7	101.5	100.7	101.7	100.8	101.1
6ヶ月			同上	同上	同上	同上	同上	同上	406.3 -1.6~5.1	411.1 -2.6~2.2	406.9 -1.7~5.5	0	2.0	6.0	0	4.0	7.0	0	1.0	8.0	101.8	101.0	102.5	101.8	101.4	100.8	101.6	101.3		
過酷試験	カプセルをシャーレに入れ光を照射する	2週間	同上	同上	同上	同上	同上	同上													101.8	100.1	100.5	100.8	102.1	101.4	100.9	101.5		
		1ヶ月	同上	同上	同上	同上	同上	同上				0	4.0	5.0	0	1.0	5.0	0	2.0	5.0	101.2	101.5	102.0	101.6	101.0	100.6	101.2	100.9		

(注)a:18号ふるいに残留するもの (%) (日局規格0%)

B:18号ふるいを通過し30号ふるいに残留するもの (%) (5%以下)

C:200号ふるいを通過するもの (%) (10%以下)

5. 調整法及び溶解後の安定性

該当資料なし

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

7. 溶出性

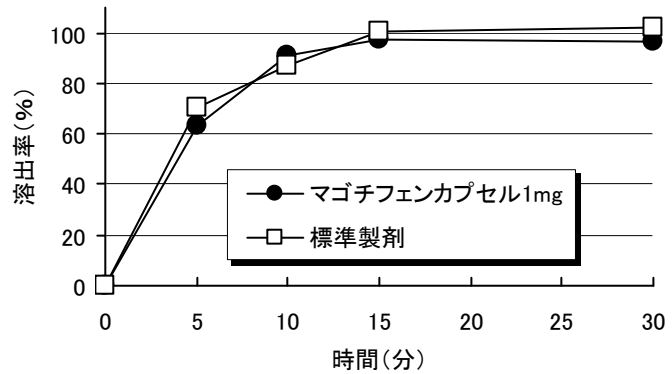
マゴチフェンカプセル 1mg の溶出は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部「ケトチフェンマル酸塩カプセル」の判定基準に適合した。（オレンジブック No.21 掲載）

試験方法：溶出試験法第 2 法（パドル法）

回転数：毎分 50 回転

試験液：水

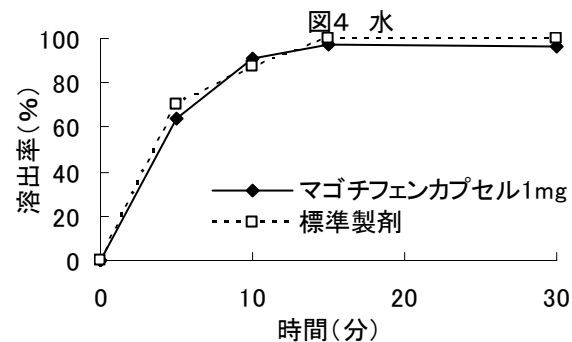
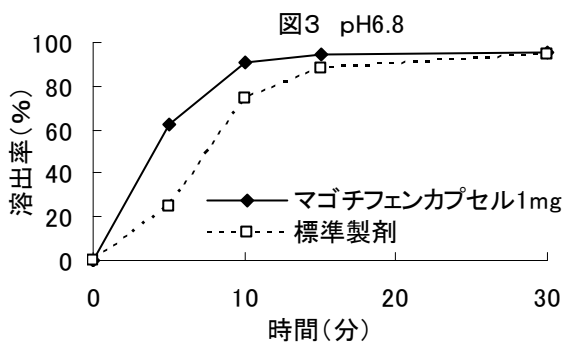
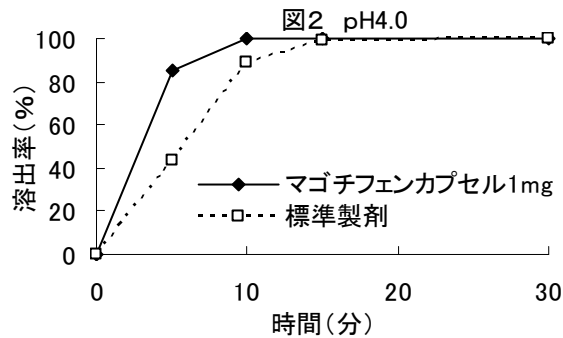
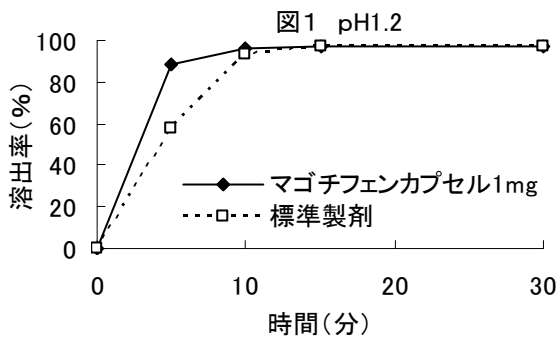
溶出規格：30 分 80%以上



マゴチフェンカプセル 1mg につき、標準製剤を対照として、下記に示す 4 種試験液を用いて溶出試験を実施した。

試験結果

標準製剤を対照としたマゴチフェンカプセル 1mg の溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。マゴチフェンカプセル 1mg の溶出パターンは、標準製剤と同等であった。



マゴチフェンドライシロップ 0.1%の溶出は、日本薬局方外医薬品規格第3部「ケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ」の判定基準に適合した。(オレンジブック No.21 掲載)

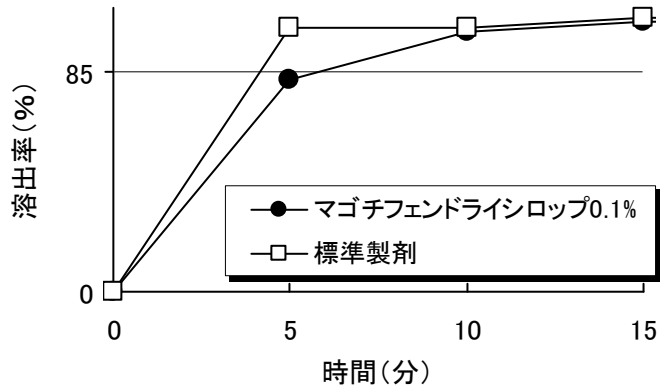
試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）

（ただし、試料は試験液に分散するように投入する）

回転数：毎分50回転

試験液：水

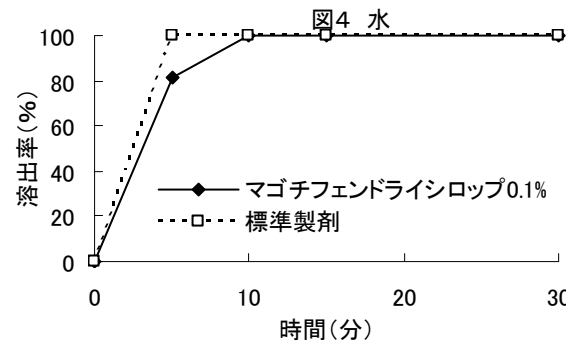
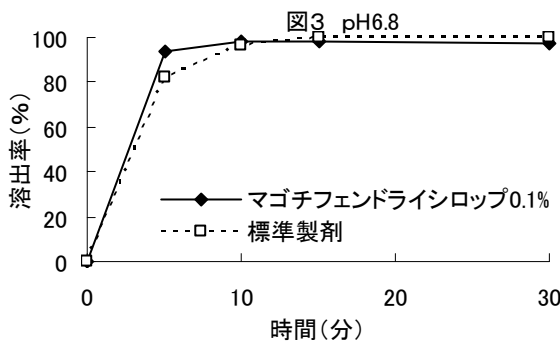
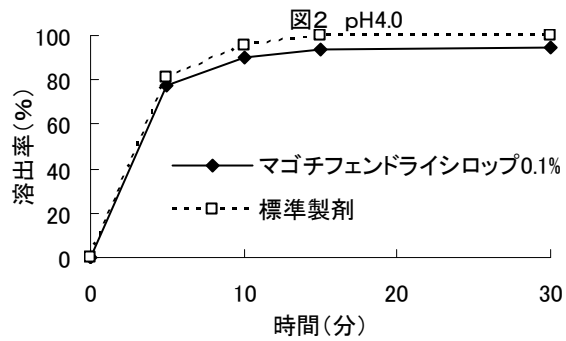
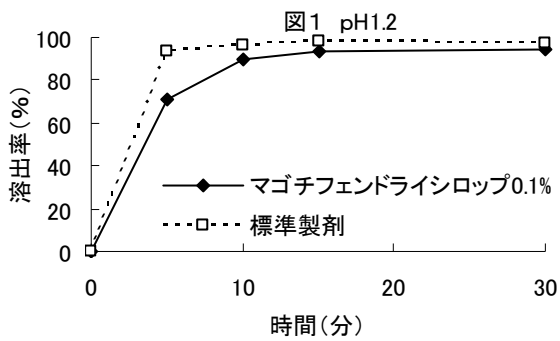
溶出規格：15分 85%以上



マゴチフェンドライシロップ 0.1%につき、標準製剤を対照として、下記に示す4種試験液を用いて溶出試験を実施した。

試験結果

標準製剤を対照としたマゴチフェンドライシロップ 0.1%の溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。マゴチフェンドライシロップ 0.1%の溶出パターンは、標準製剤と同等であった。



8. 生物学的試験法

該当資料なし

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

〈カプセル〉

- (1) 過マンガン酸カリウム試液の退色
- (2) ライネッケ塩による沈殿反応
- (3) 薄層クロマトグラフィー
- (4) 紫外可視吸光度測定法

〈ドライシロップ〉

- (1) ブロモフェノールブルー試液による呈色反応
- (2) 過マンガン酸カリウム試液の退色
- (3) 紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

〈カプセル〉 液体クロマトグラフィー

〈ドライシロップ〉 紫外可視吸光度測定法

11. 力価

特になし

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

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

2. 用法及び用量

マゴチフェンカプセル 1mg

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。

マゴチフェンドライシロップ 0.1%

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決めること。

3. 臨床成績

（1）臨床データパッケージ

該当資料なし

（2）臨床効果

該当資料なし

（3）臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

（4）探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

（5）検証的試験

1) 無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)
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試験の概要
該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ケトチフェンはラットで受動的皮膚アナフィラキシー (PCA) 反応、アナフィラキシーによる気道抵抗の増加やモルモットのアナフィラキシーによるショックを抑制する。in vitro でヒスタミンや SRS-A 等ケミカルメディエーターの遊離を抑制することが認められており 5)、また、抗ヒスタミン作用、抗 SRS-A 作用も報告されている。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

(「臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

マゴチフェンカプセル 1mg と標準製剤との生物学的同等性を検討するため、両製剤投与後の血漿中総ケトチフェンの濃度推移を比較した。

使用薬剤：

マゴチフェンカプセル 1mg

標準製剤

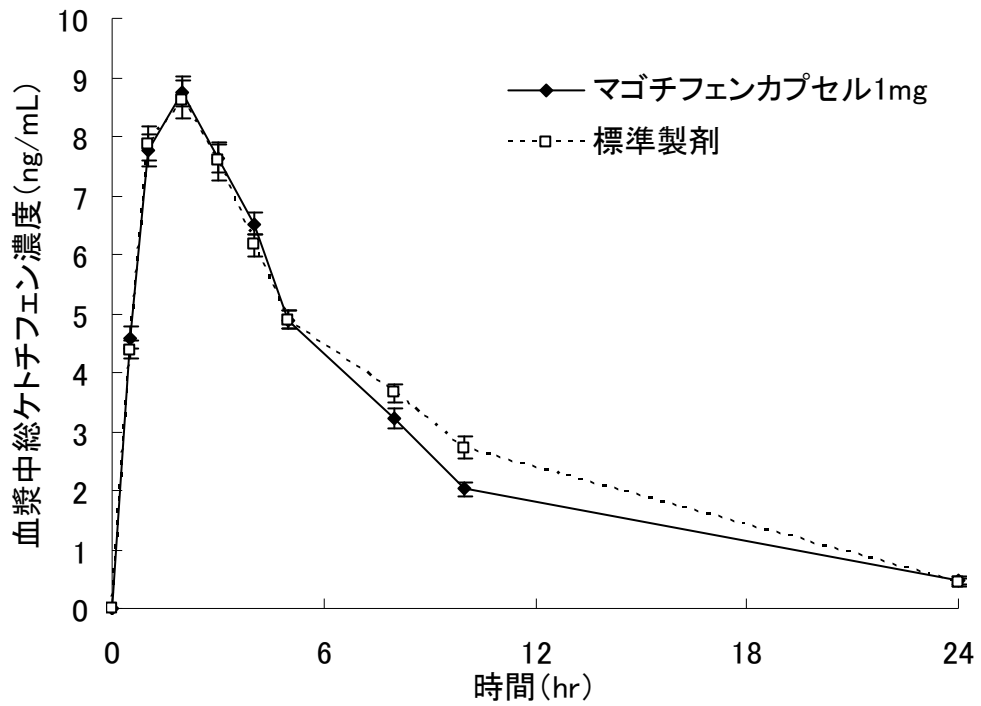
対象：あらかじめ健康診断を実施し、異常の認められなかった成人男子志願者で事前に文書による同意を得られた 12 名を対象とした。

投与量：製剤試験により同等と認められた両製剤 2 カプセルずつ (ケトチフェンとして 2mg) を経口投与した。

投与方法：クロスオーバー法を用い、対象者を 2 群に分け医師の問診の後、1 群にはマゴチフェンカプセル 1mg、他群には標準製剤を空腹時に水 150mL とともに経口投与した。ウォッシュアウト期間は 1 週間とした。

採血時間：投与前、0.5 時間、1 時間、2 時間、3 時間、4 時間、5 時間、8 時間、10 時間、24 時間

結果：総ケトチフェンの血漿中濃度は、投与後 1～3 時間後に 7.17～10.05ng/mL のピークに達した後、徐々に減少した。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。



平均値 ± 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)
マゴチフェン カプセル 1mg	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)

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。

マゴチフェンドライシロップ 0.1%と標準製剤との生物学的同等性を検討するため、両製剤投与後の血漿中総ケトチフェンの濃度推移を比較した。

実験方法

使用薬剤

マゴチフェンドライシロップ 0.1%

標準製剤

対象：あらかじめ健康診断を実施し、異常の認められなかった成人男子志願者で事前に文書による同意を得られた12名を対象とした。

投与量：製剤試験により同等と認められた両製剤2gずつ(ケトチフェンとして2mg)を経口投与した。

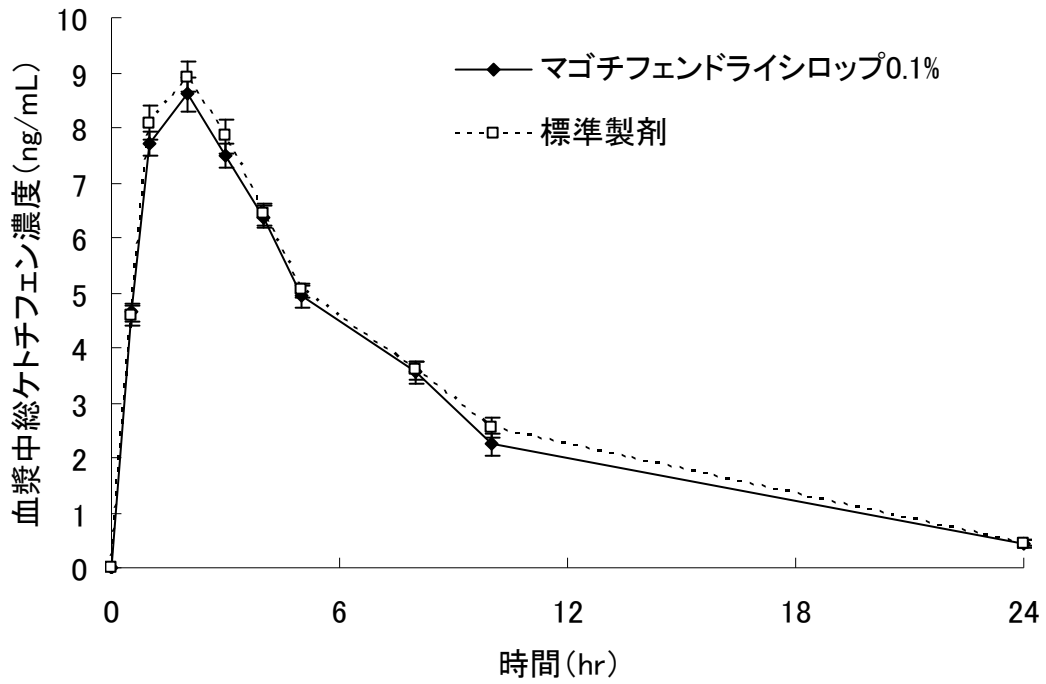
投与方法：クロスオーバー法を用い、対象者を2群に分け医師の問診の後、1群にはマゴチフェンドライシロップ0.1%、他群には標準製剤を空腹時に水150mLとともに経口投与した。ウォッシュアウト期間は1週間とした。

採血時間：投与前、0.5時間、1時間、2時間、3時間、4時間、5時間、8時間、10時間、24時間

結果：

総ケトチフェンの血漿中濃度は、投与後約1～3時間後に7.18～10.04ng/mLのピークに達した後、徐々に減少した。

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。



平均値 ± S.E.、n=12

	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)
マゴチフェン ドライシロップ 0.1%	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、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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

(「Ⅷ. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目 7.相互作用」の項を参照のこと)

(6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメーター

(1) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 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) 乳汁中への移行性

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

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由

【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。〕

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

(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)

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- 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に十分注意すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

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。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

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。

(3) 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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

該当資料なし

9. 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。

10. 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。〕

11. 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。〕

12. 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。

13. 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。

14. 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。）

15. その他の注意

該当しない

16. その他

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

該当資料なし

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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

- 1) 製剤：該当しない
- 2) 有効成分：毒薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取り扱いについて

（「規制区分」及び「貯法・保存条件」の項を参照のこと）

（2）薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 14.適用上の注意」の項を参照のこと）

5. 承認条件等

なし

6. 包装

マゴチフェンカプセル 1mg

（PTP） 100カプセル、1200カプセル

マゴチフェンドライシロップ 0.1%

（バラ） 200g

7. 容器の材質

〈カプセル〉 PTP：塩化ビニール、アルミ箔、PE袋、紙箱

〈ドライシロップ〉 バラ：PE袋、ブリキ缶

8. 同一成分・同効薬

マゴチフェンカプセル 1mg：ザジテンカプセル 1mg

マゴチフェンドライシロップ 0.1%：ザジテン ドライシロップ 0.1%

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
マゴチフェンカプセル 1mg	2008年7月29日	22000AMX01785000
マゴチフェンドライシロップ 0.1%	2008年9月4日	22000AMX01971000

[旧販売名] マゴチフェンカプセル

承認年月日：1990年9月12日

承認番号：20200AMZ00908

[旧販売名] マゴチフェンドライシロップ

承認年月日：1991年11月29日

承認番号：20300AMZ00907

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
マゴチフェンカプセル 1mg	2008年12月19日
マゴチフェンドライシロップ 0.1%	2008年12月19日

[旧販売名] マゴチフェンカプセル

薬価基準収載年月日：1992年7月10日

経過措置：2009年8月31日まで

[旧販売名] マゴチフェンドライシロップ

薬価基準収載年月日：1992年7月10日

経過措置：2009年8月31日まで

12. 効能・効果追加，用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投与期間制限医薬品に関する情報

該当しない

16. 各種コード

製品名	HOT（9桁） 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
マゴチフェンカプセル 1mg	109450317	4490003M1018	610461232
マゴチフェンドライシロップ 0.1%	109462618	4490003R1015	610461231

17. 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) 鶴原製薬株式会社 社内資料

2. その他の参考文献

第 1 6 改正 日本薬局方

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

X III . 備 考

1. その他の関連資料

なし



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

文献請求先：鶴原製薬（株）医薬情報部