

アレルギー性疾患治療剤

日本薬局方 フェキソフェナジン塩酸塩錠

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE

フェキソフェナジン塩酸塩製剤

貯法:

錠30mg/60mg : 室温保存

OD錠30mg/60mg : 室温保存(開封後は湿気を避けて保存すること)

使用期限: 外箱に表示

日本標準商品分類番号

87449

	錠30mg	錠60mg
承認番号	22500AMX01499000	22500AMX01500000
薬価収載	2013年12月	2013年12月
販売開始	2013年12月	2013年12月

	OD錠30mg	OD錠60mg
承認番号	22500AMX01545000	22500AMX01546000
薬価収載	2013年12月	2013年12月
販売開始	2013年12月	2013年12月

【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】

組成

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」: 1錠中に日局フェキソフェナジン塩酸塩30mgを含有する。

添加物として、カルナウバロウ、クロスカルメロースNa、結晶セルロース、酸化チタン、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、部分アルファー化デンプン、マクロゴール400を含有する。

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」: 1錠中に日局フェキソフェナジン塩酸塩60mgを含有する。

添加物として、カルナウバロウ、クロスカルメロースNa、結晶セルロース、酸化チタン、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、部分アルファー化デンプン、マクロゴール400を含有する。

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」: 1錠中に日局フェキソフェナジン塩酸塩30mgを含有する。

添加物として、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、アミノアルキルメタクリレートコポリマーE、クロスポビドン、結晶セルロース、タウマチン、二酸化ケイ素、フマル酸ステアリンNa、ポビドン、D-マンニトール、香料を含有する。

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」: 1錠中に日局フェキソフェナジン塩酸塩60mgを含有する。

添加物として、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、アミノアルキルメタクリレートコポリマーE、クロスポビドン、結晶セルロース、タウマチン、二酸化ケイ素、フマル酸ステアリンNa、ポビドン、D-マンニトール、香料を含有する。

製剤の性状

品名	剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)			性状
		直径(mm)	重量(mg)	厚さ(mm)	
フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」	フィルムコーティング錠	 6.4	 約107	 3.6	うすい だいだい色
フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」	割線入りフィルムコーティング錠	 12.3×5.6	 約212	 4.2	うすい だいだい色
フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」	素錠 (口腔内崩壊錠)	 8.0	 約190	 3.8	白色
フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」	割線入り素錠 (口腔内崩壊錠)	 10.0	 約380	 5.1	白色

【効能・効果】

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、アトピー性皮膚炎)に伴うそう痒

【用法・用量】

通常、成人にはフェキソフェナジン塩酸塩として1回60mgを1日2回経口投与する。

通常、7歳以上12歳未満の小児にはフェキソフェナジン塩酸塩として1回30mgを1日2回、12歳以上の小児にはフェキソフェナジン塩酸塩として1回60mgを1日2回経口投与する。

なお、症状により適宜増減する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

OD錠は口腔内で崩壊するが、口腔の粘膜から吸収されることはないため、唾液又は水で飲み込むこと。(「適用上の注意」の項参照)

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

- 1) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
- 2) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

2. 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
制酸剤(水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウム含有製剤)	本剤の作用を減弱させることがあるので、同時に服用させないなど慎重に投与すること。	水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウムが本剤を一時的に吸着することにより吸収量が減少することによるものと推定される。
エリスロマイシン	本剤の血漿中濃度を上昇させるとの報告がある。	P糖蛋白の阻害による本剤のクリアランスの低下及び吸収率の増加に起因するものと推定される。

3. 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) **ショック、アナフィラキシー**：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、呼吸困難、血圧低下、意識消失、血管浮腫、胸痛、潮紅等の過敏症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (2) **肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP、Al-P、LDHの上昇等の肝機能障害、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) **無顆粒球症、白血球減少、好中球減少**：無顆粒球症、白血球減少、好中球減少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
精神神経系	頭痛、眠気、疲労、倦怠感、めまい、不眠、神経過敏、悪夢、睡眠障害、しびれ感
消化器	嘔気、嘔吐、口渇、腹痛、下痢、消化不良、便秘
過敏症 ^{注1)}	血管浮腫、痒疹、蕁麻疹、潮紅、発疹
肝臓 ^{注2)}	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇
腎臓・泌尿器	排尿困難、頻尿
循環器	動悸、血圧上昇
その他	呼吸困難、味覚異常、浮腫、胸痛、月経異常

- 注1) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。
 注2) このような異常があらわれた場合には、減量、休薬等の適切な処置を行うこと。

4. 高齢者への投与

高齢者では腎機能が低下していることが多く、腎臓からも排泄される本剤では血中濃度が上昇する場合がありますので、異常が認められた場合には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) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。〔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

低出生体重児、新生児、乳児、幼児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

7. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルゲン皮内反応を抑制するため、アレルゲン皮内反応検査を実施する3～5日前から本剤の投与を中止すること。

8. 過量投与

過量投与に関する報告は限られており、外国での過量服用症例報告には用量が不明な症例が多いが、最も高用量を服用した2例(1800～3600mg)では、症状はないかあるいはめまい、眠気及び口渇が報告されている。過量投与例においては、吸収されずに残っている薬物を通常の方法で除去すること及び、その後の処置は対症的、補助的療法を検討すること。なお、本剤は血液透析によって除去できない。

9. 適用上の注意

- 1) **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、更には穿孔をお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)
- 2) **服用時**(OD錠：口腔内崩壊錠)：
 - (1) 本剤は舌の上のせ唾液を浸潤させ、崩壊後唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。
 - (2) 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用しないこと。

【薬物動態】

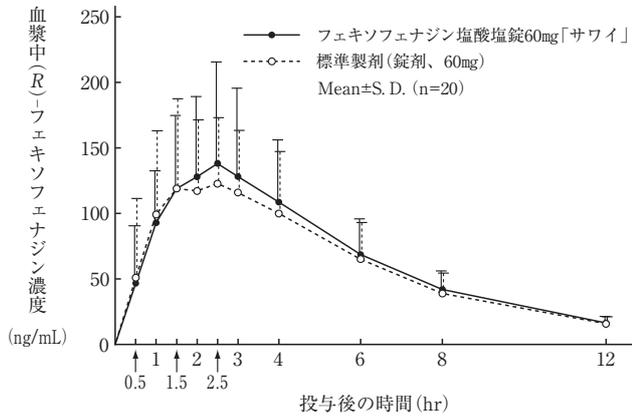
1. 生物学的同等性試験

- フェキシフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」
 フェキシフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成18年11月24日付 薬食審査発第1124004号)」に基づき、フェキシフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。¹⁾
- フェキシフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」
 フェキシフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(フェキシフェナジン塩酸塩として60mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中(R)-フェキシフェナジン濃度を測定した。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。²⁾

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-12hr} (ng·hr/mL)
フェキシフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」	157.8 ± 73.8	2.3 ± 1.0	3.0 ± 0.4	817.0 ± 299.4
標準製剤(錠剤、60mg)	150.5 ± 67.9	2.1 ± 0.7	3.1 ± 0.4	769.6 ± 308.5

(Mean ± S. D.)



血漿中濃度ならびに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。

○フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」は、「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成18年11月24日付 薬食審査発第1124004号)」に基づき、フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」を標準剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。³⁾

○フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」

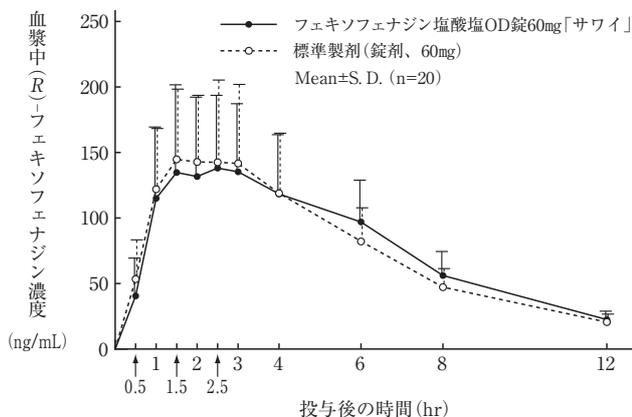
フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」と標準剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(フェキソフェナジン塩酸塩として60mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中(R)-フェキソフェナジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。⁴⁾

各剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-12hr} (ng·hr/mL)
水なし	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」	160.4±57.2	2.6±1.4	2.9±0.4	966.0±304.3
	標準剤(錠剤、60mg)	164.8±61.9	2.3±1.0	3.2±0.6	934.6±294.0
水あり	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」	166.3±74.0	2.2±1.1	3.2±0.7	966.6±379.1
	標準剤(錠剤、60mg)	164.8±72.4	2.0±1.0	3.1±0.7	945.7±323.5

(Mean ± S. D., n=20)

〈水なしで服用時の血中濃度曲線〉



血漿中濃度ならびに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。

2. 溶出挙動

錠30mg及び錠60mgは、日本薬局方に定められた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】

フェキソフェナジンは、選択的なヒスタミンH₁受容体拮抗作用を示す。また、ケミカルメディエーター遊離抑制作用、炎症性サイトカイン産生抑制作用及び好酸球遊走抑制作用も有する。

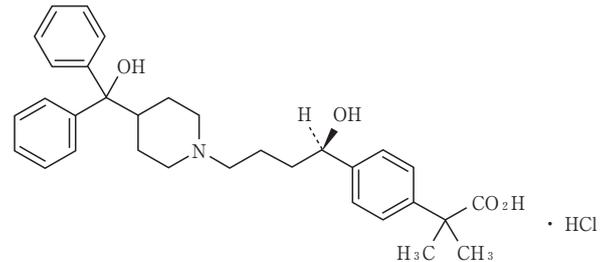
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：フェキソフェナジン塩酸塩 (Fexofenadine Hydrochloride)
化学名：2-(4-((1R)-1-Hydroxy-4-[4-(hydroxydiphenylmethyl)piperidin-1-yl]butyl)phenyl)-2-methylpropanoic acid monohydrochloride

分子式：C₃₂H₃₉NO₄ · HCl

分子量：538.12

構造式：



及び鏡像異性体

性状：フェキソフェナジン塩酸塩は白色の結晶性の粉末である。メタノールに極めて溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けやすく、水に溶けにくい。メタノール溶液(3→100)は旋光性を示さない。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

錠30mg/錠60mg：PTP包装又はバラ包装したものをを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、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。^{5)、6)}

OD錠30mg/OD錠60mg：PTP包装(PTPシートをアルミピロー包装(乾燥剤入り))又はバラ包装(ポリエチレン瓶(乾燥剤入り))したものをを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、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。^{7)、8)}

【包装】

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)、140錠(14錠×10)、500錠(10錠×50)

バラ：200錠

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

バラ：100錠

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

1)～4) 沢井製薬(株)社内資料 [生物学的同等性試験]

5)～8) 沢井製薬(株)社内資料 [安定性試験]

・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター

〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30

TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

製造販売元
沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K01 A131001