

貯 法：気密容器に入れ、室温保存

使用期限：外箱等に表示(3年)

	錠30mg	錠60mg	DS6%
承認番号	22500AMX01496	22500AMX01497	22600AMX00408
薬価収載	2013年12月	2013年12月	2014年6月
販売開始	2013年12月	2013年12月	2014年6月

アレルギー性疾患治療剤

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「タカタ」

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」

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DS6%「タカタ」

シロップ用フェキソフェナジン塩酸塩
FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE



【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】




1. 組成




品 名	フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「タカタ」
成分・分量	1錠中 フェキソフェナジン塩酸塩 30mg
添 加 物	結晶セルロース、部分アルファー化デンプン、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

品 名	フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」
成分・分量	1錠中 フェキソフェナジン塩酸塩 60mg
添 加 物	結晶セルロース、部分アルファー化デンプン、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

品 名	フェキソフェナジン塩酸塩DS6%「タカタ」
成分・分量	1g中 フェキソフェナジン塩酸塩 60mg
添 加 物	D-マンニトール、エチルセルロース、タルク、トリアセチン、ヒプロメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、アスパルテム(L-フェニルアラニン化合物)、サッカリンナトリウム水和物、カラメル、ステビア抽出精製物、アセスルファムカリウム、ステアリン酸マグネシウム、香料

2. 性状

品 名	フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「タカタ」		
性 状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠		
外 形	表 面 直 径	裏 面 重 さ	側 面 厚 さ
	 約6.6mm	 約0.105g	 約3.4mm
識別コード	TTS-701		

品 名	フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」		
性 状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠		
外 形	表 面 直 径	裏 面 重 さ	側 面 厚 さ
	 長径約12.2mm 短径約 5.6mm	 約0.208g	 約4.1mm
識別コード	TTS-702		

品 名	フェキソフェナジン塩酸塩DS6%「タカタ」
性 状	微黄白色の微粒又は粉末で、味は甘い。

【効能・効果】

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、アトピー性皮膚炎)に伴う掻痒

【用法・用量】

錠：

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。

ドライシロップ：

通常、成人にはフェキソフェナジン塩酸塩として1回60mg(ドライシロップとして1g)を1日2回、用時懸濁して経口投与する。

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(ドライシロップとして0.5g)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(ドライシロップとして1g)を1日2回、用時懸濁して経口投与する。

なお、症状により適宜増減する。

【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、好発季節を考えて、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、掻痒、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)症状があらわれた場合には、投与を中止すること。(太字)

注2)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。(太字)

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。]
- (2) 調製時：ドライシロップ製剤は用時調製の製剤であるので、調製後の保存は避け、水に懸濁後は速やかに使用すること。

【薬物動態】

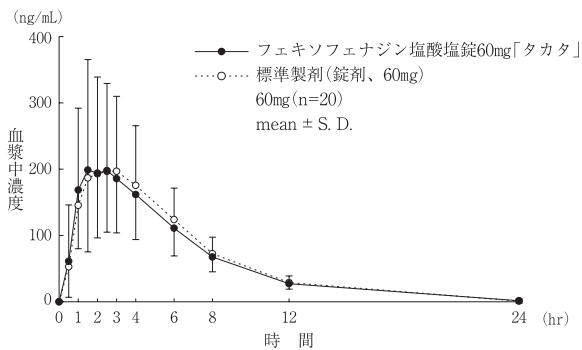
1. 生物学的同等性試験

(1) フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「タカタ」¹⁾

本剤はフェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「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」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

(2) フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」¹⁾

本剤と標準製剤(錠剤、60mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子20名にそれぞれ1錠(フェキソフェナジン塩酸塩として60mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12及び24時間に前腕静脈から採血した。LC/MSにより測定したフェキソフェナジンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



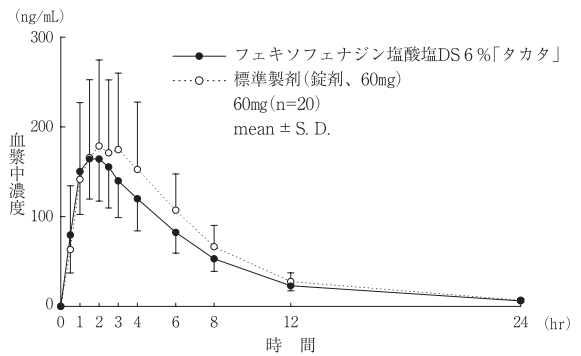
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」	1444.6 ± 501.5	246.5 ± 122.2	2.1 ± 1.2	3.3 ± 0.7
標準製剤(錠剤、60mg)	1501.6 ± 686.5	252.1 ± 169.4	2.6 ± 1.0	3.1 ± 0.6

(mean ± S. D.)

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。

(3) フェキソフェナジン塩酸塩DS 6%「タカタ」²⁾

本剤と標準製剤(錠剤、60mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子20名にそれぞれ1g及び1錠(フェキソフェナジン塩酸塩として60mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12及び24時間に前腕静脈から採血した。LC/MSにより測定したフェキソフェナジンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
フェキソフェナジン塩酸塩DS 6%「タカタ」	1185.7 ± 271.8	180.4 ± 46.7	1.6 ± 0.6	5.3 ± 0.8
標準製剤(錠剤、60mg)	1395.8 ± 529.4	213.8 ± 95.7	2.2 ± 1.3	5.0 ± 0.7

(mean ± S. D.)

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。

2. 溶出挙動^{3,4)}

錠剤は、日本薬局方医薬品各条に定められたフェキソフェナジン塩酸塩錠の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】

抗原抗体反応に伴って起こる肥満細胞からのヒスタミンなどのケミカルメディエーターの遊離を抑制するとともに、ヒスタミンのH₁作用に拮抗することによりアレルギー症状を緩和する。

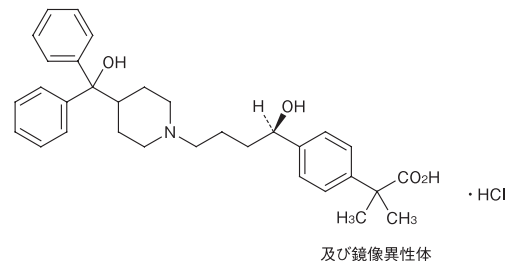
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：フェキソフェナジン塩酸塩[日局]

Fexofenadine Hydrochloride

化学名：2-(4-{(1*R,S*)-1-Hydroxy-4-[4-(hydroxydiphenylmethyl)piperidin-1-yl]butyl}phenyl)-2-methylpropanoic acid monohydrochloride

構造式：



分子式：C₃₂H₃₉NO₄ · HCl

分子量：538.12

性状：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。

結晶多形が認められる。

【取扱い上の注意】

安定性試験

1. フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「タカタ」、フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」^{5,6)}
最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、3年間安定であることが推測された。
2. フェキソフェナジン塩酸塩DS 6%「タカタ」⁷⁾
最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)及び長期保存試験(25℃、60%RH、24ヵ月)の結果、3年間安定であることが推測された。

【包 装】

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「タカタ」

PTP包装：100錠(10錠×10)

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」

PTP包装：100錠(10錠×10)

フェキソフェナジン塩酸塩DS 6%「タカタ」

分 包：0.5g×120包

1g×120包

バラ包装：100g(プラスチック瓶)

【主要文献】

- 1) 高野和彦他：診療と新薬, 50(9)：837, 2013.
- 2) 高田製薬株式会社内資料(DS 6%：生物学的同等性)
- 3) 高田製薬株式会社内資料(錠30mg：溶出性)
- 4) 高田製薬株式会社内資料(錠60mg：溶出性)
- 5) 高田製薬株式会社内資料(錠30mg：安定性)
- 6) 高田製薬株式会社内資料(錠60mg：安定性)
- 7) 高田製薬株式会社内資料(DS 6%：安定性)

【文献請求先】**

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

高田製薬株式会社 学術部

〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

今回
改訂
→

製造販売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1