

貯 法：室温保存  
有効期間：3年**フェキソフェナジン** 塩酸塩錠 30mg「アメル」  
**フェキソフェナジン** 塩酸塩錠 60mg「アメル」

Fexofenadine Hydrochloride Tablets 「AMEL」

	錠30mg	錠60mg
承認番号	22500AMX00052	22500AMX00051
販売開始	2013年6月	2013年6月



**2. 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

**3. 組成・性状****3.1 組成**

販売名	フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「アメル」	フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「アメル」
有効成分	1錠中、日局フェキソフェナジン塩酸塩30mgを含有する。	1錠中、日局フェキソフェナジン塩酸塩60mgを含有する。
添加剤	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、ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ	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、ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

**3.2 製剤の性状**

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「アメル」	フィルムコーティング錠		Kw FE 30
	うすいだいだい色	直径：約6.6mm 厚さ：約3.4mm 質量：約104mg	
フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「アメル」	フィルムコーティング錠		Kw FE 60
	うすいだいだい色	直径：約8.6mm 厚さ：約4.2mm 質量：約206mg	

**4. 効能又は効果**

- 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

**6. 用法及び用量**

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。**8. 重要な基本的注意**

〈効能共通〉

8.1 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。

〈アレルギー性鼻炎〉

8.2 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。

**9. 特定の背景を有する患者に関する注意****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。

**9.6 授乳婦**

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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。

**9.7 小児等**

低出生体重児、新生児、乳児、幼児を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

**9.8 高齢者**

異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。腎機能が低下していることが多く、血中濃度が上昇する可能性がある。[16.6.1 参照]

**10. 相互作用****10.2 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
エリスロマイシン[16.7.1、17.3.1参照]	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。
水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウム含有製剤[16.7.2参照]	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。

**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。

**11.1 重大な副作用****11.1.1 ショック、アナフィラキシー**（いずれも頻度不明）  
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。**11.1.2 肝機能障害、黄疸**（いずれも頻度不明）AST、ALT、 $\gamma$ -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。

11.1.3 無顆粒球症（頻度不明）、白血球減少（0.2%）、好中球減少（0.1%未満）

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	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	そう痒	蕁麻疹、潮紅、発疹	血管浮腫
肝臓	AST上昇、ALT上昇		
腎臓・泌尿器		頻尿	排尿困難
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	

発現頻度は使用成績調査を含む

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

アレルギー皮膚反応を抑制するため、アレルギー皮膚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。

13. 過量投与

13.1 症状

外国での過量投与症例として高用量を服用した2例の報告があり、1800mgを服用した症例では症状はなく、3600mgを服用した症例では、めまい、眠気及び口渇がみられた。

13.2 処置

本剤は血液透析によって除去できない。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

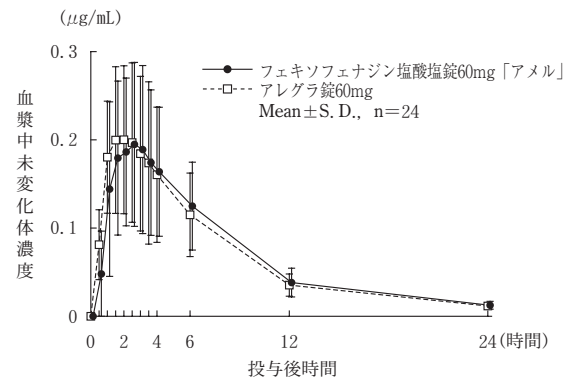
16.1.1 生物学的同等性試験

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「アメル」とアレグラ錠60mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（フェキソフェナジン塩酸塩として60mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、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（0.80）～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<sup>1)</sup>。

薬物動態パラメータ（生物学的同等性）

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>(0-24)</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「アメル」	1.68 ± 0.64	0.23 ± 0.10	2.44 ± 1.35	5.49 ± 0.76
アレグラ錠60mg	1.66 ± 0.62	0.23 ± 0.09	2.13 ± 1.16	5.53 ± 0.75

(Mean ± S.D., n=24)



血漿中未変化体濃度（生物学的同等性）

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。

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 高齢者

65歳以上の健康高齢者20例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル80mg<sup>注1)</sup>を単回投与したときのフェキソフェナジンのAUC<sub>0-∞</sub>は2906ng・hr/mL、Cmaxは418ng/mL、t<sub>1/2</sub>は15.2hrであった。これらの値は健康若年者における値のそれぞれ1.6、1.6、1.1倍であった<sup>2)</sup>（外国人データ）。[9.8 参照]

注1) 成人におけるフェキソフェナジン塩酸塩の承認用量は1回60mg、1日2回である。

16.7 薬物相互作用

16.7.1 エリスロマイシン

健康成人男子18例にフェキソフェナジン塩酸塩円形錠<sup>注2)</sup>1回120mg1日2回<sup>注1)</sup>とエリスロマイシン1回300mg1日4回7日間併用して反復経口投与したとき、血漿中フェキソフェナジンのCmaxはフェキソフェナジン塩酸塩単回投与時の約2倍に上昇した。一方、血漿中エリスロマイシン濃度には、併用による影響はなかった。

この血漿中フェキソフェナジン濃度上昇の機序は動物試験から、P糖蛋白の阻害によるフェキソフェナジン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た<sup>3),4)</sup>。[10.2、17.3.1 参照]

注2) フェキソフェナジン塩酸塩円形錠とアレグラ錠60mgは生物学的に同等であった<sup>5)</sup>。

16.7.2 水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウム含有製剤

健康成人男子22例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル120mg<sup>注1)</sup>の投与15分前に水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウム含有製剤を単回投与したとき、フェキソフェナジンのAUC<sub>0-30</sub>及びCmaxはフェキソフェナジン塩酸塩単回投与時の約40%減少した<sup>6)</sup>（外国人データ）。[10.2 参照]

16.8 その他

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「アメル」について、「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 薬食審査発第1124004号）」に基づき、フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「アメル」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等と判断され、生物学的に同等とみなされた<sup>7)</sup>。

17. 臨床成績

17.3 その他

17.3.1 心血管系へ及ぼす影響

(1) 成人の季節性アレルギー性鼻炎患者にフェキソフェナジン塩酸塩を1回240mgまで1日2回<sup>注)</sup>2週間投与したとき、プラセボと比較して、QTc間隔の有意な変化は見られなかった<sup>8)</sup>（外国人データ）。

(2) 健康成人にフェキソフェナジン塩酸塩を1回60mg1日2回6ヵ月、1回400mg1日2回6.5日間及び240mg1日1回1年

間投与しても、プラセボに比して、QTc間隔の有意な変動はみられなかった<sup>9)</sup> (外国人データ)。

- (3) 健康成人男子を対象にしたエリスロマイシンとの薬物相互作用の検討 (フェキソフェナジン塩酸塩1回60mg及び120mg1日2回7日間、エリスロマイシン1回300mg1日4回7日間) において、併用により血漿中フェキソフェナジン塩酸塩濃度が約2倍に上昇した場合でもQTcなどの心電図を含め安全性に問題はみられなかった<sup>4)</sup>。  
[10.2、16.7.1 参照]
- (4) Cmaxが承認用量投与時の10倍以上となる条件下での検討において、心電図への影響はなく、有害事象の増加も認められなかった<sup>10)</sup> (外国人データ)。
- (5) フェキソフェナジン塩酸塩にはクロロ化したヒト心筋遅延整流K<sup>+</sup>チャネルに対する影響は認められていない<sup>11)</sup>。

注) 成人におけるフェキソフェナジン塩酸塩の承認用量は1回60mg、1日2回である。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

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共に、ヒスタミンのH<sub>1</sub>作用に拮抗することにより、アレルギー症状を緩和する<sup>12)</sup>。

## 19. 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-[(1*R,S*)-1-Hydroxy-4-[4-(hydroxydiphenylmethyl)piperidin-1-yl]butyl]phenyl)-2-methylpropanoic acid monohydrochloride

### 分子式

C<sub>32</sub>H<sub>39</sub>NO<sub>4</sub> · HCl

### 分子量

538.12

### 性状

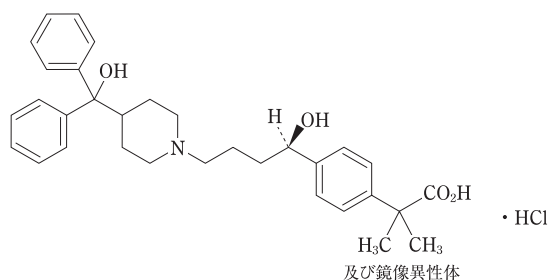
白色の結晶性の粉末である。

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。

本品のメタノール溶液 (3→100) は旋光性を示さない。

結晶多形が認められる。

### 構造式



## 22. 包装

〈フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「アメル」〉

100錠[10錠 (PTP) ×10]

〈フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「アメル」〉

100錠[10錠 (PTP) ×10]

## 23. 主要文献

- 1) 社内資料：生物学的同等性試験[錠60mg]
- 2) 高齢者における薬物動態 (アレグラ錠：2000年9月22日承認、申請資料概要 へ.III.3. (2))

3) 浦江明憲, 他：臨床薬理. 2000；31 (5)：639-648

4) エリスロマイシンとの相互作用 (アレグラ錠：2000年9月22日承認、申請資料概要 へ.III.2. (1)、ト.I.5. (1))

5) 健康成人における生物学的同等性試験 (アレグラ錠：2000年9月22日承認、申請資料概要 へ.III.4)

6) 水酸化アルミニウムゲル・水酸化マグネシウムとの相互作用 (アレグラ錠：2000年9月22日承認、申請資料概要 へ.III.2. (4))

7) 社内資料：生物学的同等性試験 (溶出挙動比較)

8) Pratt, C.M., et al. : Am. J. Cardiol. 1999；83：1451-1454

9) Pratt, C., et al. : Clin. Exp. Allergy. 1999；29 (Suppl.3)：212-216

10) 高用量における心電図の検討試験 (アレグラ錠：2000年9月22日承認、申請資料概要 ト.I.5. (4))

11) QTc間隔延長の可能性に関する検討 (アレグラ錠：2000年9月22日承認、申請資料概要 ホ.II.2. (1))

12) 第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店. 2021；C-4567

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口

〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4

☎ 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

**共和薬品工業株式会社**

大阪市北区中之島3-2-4