

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

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

剤形	錠30mg：フィルムコーティング錠 錠60mg：割線入りフィルムコーティング錠 OD錠30mg：素錠(口腔内崩壊錠) OD錠60mg：割線入り素錠(口腔内崩壊錠)
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠30mg/OD錠30mg：1錠中日局フェキソフェナジン塩酸塩30mg含有 錠60mg/OD錠60mg：1錠中日局フェキソフェナジン塩酸塩60mg含有
一般名	和名：フェキソフェナジン塩酸塩 洋名：Fexofenadine Hydrochloride
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2013年 8月15日 薬価基準収載年月日：2013年12月13日 発売年月日：2013年12月13日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-6394-7355 医療関係者向けホームページ： http://med.sawai.co.jp

本IFは2013年10月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

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。

IF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、医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IF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

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、一色刷りとする。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「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」(以下、「IF記載要領2013」と略す)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「IF記載要領2013」は、平成25年10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2013」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

「IF記載要領2013」においては、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ある。

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、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。

(2013年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	27
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	27
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	27
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	27
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	27
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	27
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	27
4. 分子式及び分子量	3	7. 相互作用	27
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	28
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	29
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	29
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	29
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	29
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	29
3. 有効成分の確認試験法	4	14. 適用上の注意	30
4. 有効成分の定量法	4	15. その他の注意	30
IV. 製剤に関する項目	5	16. その他	30
1. 剤形	5	IX. 非臨床試験に関する項目	31
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	31
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	2. 毒性試験	31
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	X. 管理的事項に関する項目	32
5. 調製法及び溶解後の安定性	11	1. 規制区分	32
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	11	2. 有効期間又は使用期限	32
7. 溶出性	11	3. 貯法・保存条件	32
8. 生物学的試験法	17	4. 薬剤取扱い上の注意点	32
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	17	5. 承認条件等	32
10. 製剤中の有効成分の定量法	17	6. 包装	32
11. 力価	17	7. 容器の材質	33
12. 混入する可能性のある夾雑物	18	8. 同一成分・同効薬	33
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	18	9. 国際誕生年月日	33
14. その他	18	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	33
V. 治療に関する項目	19	11. 薬価基準収載年月日	34
1. 効能又は効果	19	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	34
2. 用法及び用量	19	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	34
3. 臨床成績	19	14. 再審査期間	34
VI. 薬効薬理に関する項目	21	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	34
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	21	16. 各種コード	34
2. 薬理作用	21	17. 保険給付上の注意	34
VII. 薬物動態に関する項目	22	XI. 文献	35
1. 血中濃度の推移・測定法	22	1. 引用文献	35
2. 薬物速度論的パラメータ	25	2. その他の参考文献	35
3. 吸収	25	XII. 参考資料	36
4. 分布	25	1. 主な外国での発売状況	36
5. 代謝	26	2. 海外における臨床支援情報	36
6. 排泄	26	XIII. 備考	36
7. トランスポーターに関する情報	26	その他の関連資料	36
8. 透析等による除去率	26		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg/錠60mg/OD錠30mg/OD錠60mg「サワイ」は、日局フェキソフェナジン塩酸塩を含有するアレルギー性疾患治療剤である。

フェキソフェナジン塩酸塩は、選択的なヒスタミンH₁受容体拮抗作用を示し、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。本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第0331015号(平成21年3月4日 薬食発第0304004号により一部改正)
承認	2013年8月
上市	2013年12月

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) PTPシートに「抗アレルギー剤」の文字を記載している。
- 2) 水なし(唾液のみ)でも服用可能な口腔内崩壊錠である。[OD錠30mg/OD錠60mg]
- 3) 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。¹⁾
- 4) 眠気の発現率、自動車の運転や危険を伴う機械の操作等の日常作業への影響において、プラセボと差がないことが確認されている。²⁾
- 5) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、肝機能障害、黄疸、無顆粒球症、白血球減少、好中球減少が報告されている(頻度不明)。
また、その他の副作用として、頭痛、眠気、嘔気、嘔吐、そう痒、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇等が報告されている(頻度不明)。

II. 名称に関する項目

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

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」

2) 洋名

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

フェキソフェナジン塩酸塩(JAN)

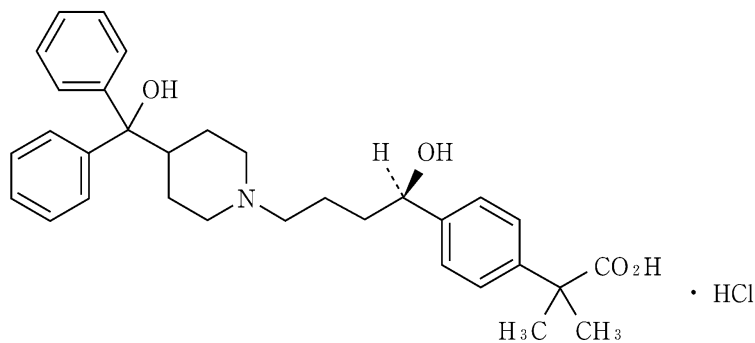
2) 洋名(命名法)

Fexofenadine Hydrochloride(JAN)
Fexofenadine(INN)

3) ステム

不明

3. 構造式又は示性式



及び鏡像異性体

4. 分子式及び分子量
分子式 : $C_{32}H_{39}NO_4 \cdot HCl$
分子量 : 538.12
5. 化学名(命名法)
2-(4-((1*RS*)-1-Hydroxy-4-[4-(hydroxydiphenylmethyl)piperidin-1-yl]butyl}phenyl)-
2-methylpropanoic acid monohydrochloride(IUPAC)
6. 慣用名、別名、略号、記号番号
別名 : 塩酸フェキソフェナジン
7. CAS登録番号
153439-40-8[Fexofenadine Hydrochloride]
83799-24-0[Fexofenadine]





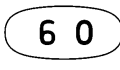
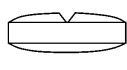






Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………
 - 1) 外観・性状
白色の結晶性の粉末である。
 - 2) 溶解性
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。
 - 3) 吸湿性
水分：0.5%以下(0.25g、電量滴定法)
 - 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点
該当資料なし
 - 5) 酸塩基解離定数
pKa：4.25及び9.53(25°C)³⁾
 - 6) 分配係数
2.0⁴⁾
 - 7) その他の主な示性値
メタノール溶液(3→100)は旋光性を示さない。
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……………
日局「フェキソフェナジン塩酸塩」の確認試験に準ずる。
 - 1) 紫外可視吸光度測定法による確認
 - 2) 赤外吸収スペクトル測定法による確認
 - 3) 塩化物の定性反応
4. 有効成分の定量法……………
日局「フェキソフェナジン塩酸塩」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別、外観及び性状

品名	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
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

2) 製剤の物性

●フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg/錠60mg「サワイ」

製剤均一性：日局フェキソフェナジン塩酸塩錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局フェキソフェナジン塩酸塩錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg/OD錠60mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

3) 識別コード

●フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」：SW F30(錠剤本体に記載)

●フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」：SW F60(錠剤本体に記載)

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」：SW FX30(錠剤本体に記載)

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」：SW FX60(錠剤本体に記載)

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

IV. 製剤に関する項目

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量

●フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg/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

●フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg/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

2) 添加物

●フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」

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」

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」

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、フマル酸ステアリル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」

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、フマル酸ステアリルNa、ポビドン、D-マンニトール、香料を含有する。

3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

●フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。⁵⁾

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6カ月
性状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.2	100.6

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。⁶⁾

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3カ月)	湿度 (25°C75%RH 3カ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3カ月)
性状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	13.3	12.4	10.2	10.6	11.1
定量試験※	100.0	100.4	100.4	99.9	100.0

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

<補足>

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、溶出試験を行った。

その結果、問題なく規格に適合することが確認された。⁷⁾

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3カ月)	湿度 (25°C75%RH 3カ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3カ月)
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし

●フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。⁸⁾

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6カ月
性状	うすいだいだい色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.6	100.1

※：表示量に対する含有率(%)

IV. 製剤に関する項目

2) バラ包装品の安定性(加速試験)

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。⁸⁾

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	うすいだいだい色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験 [*]	100.6	100.3

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。⁹⁾

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	うすいだいだい色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	22.6	22.1	16.2	16.5	17.9
定量試験 [*]	100.0	98.9	99.0	100.0	99.2

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

<補足>

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、溶出試験を行った。

その結果、問題なく規格に適合することが確認された。¹⁰⁾

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。¹¹⁾

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.8	100.2

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、温度、光及び室温の条件下で安定な製剤であることが確認された。¹²⁾

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)
性状	白色の素錠	変化なし	(試験中)
硬度(kg)	5.0	5.3	(試験中)
純度試験	問題なし	問題なし	(試験中)
崩壊試験	問題なし	問題なし	(試験中)
溶出試験	問題なし	問題なし	(試験中)
定量試験※	100.0	98.7	(試験中)

保存条件	イニシャル	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	白色の素錠	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.0	4.2	4.2
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	97.7	98.2

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。¹³⁾

IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.0	99.9

※：表示量に対する含有率(%)

2)バラ包装品の安定性(加速試験)

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶、乾燥剤入り)したのについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。¹³⁾

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.0	99.2

※：表示量に対する含有率(%)

3)無包装下の安定性

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件下で性状変化及び硬度低下が観察された。¹⁴⁾

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度(25°C75%RH)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の割線入り素錠	変化なし	錠剤同士の軽い 接着	錠剤同士の軽い 接着
硬度(kg)	5.7	5.7	3.1	2.9
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.3	97.2	98.0

保存条件	イニシャル	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.7	4.0	4.5
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.4	98.6

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

5. 調製法及び溶解後の安定性……………
該当しない

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……………
〈溶出挙動における同等性及び類似性〉

●フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」¹⁵⁾

本剤は、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。

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水)、100rpm(pH4.0)
試験回数	12 ベッセル	
試験製剤	フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」	
標準製剤	フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」	

【結果及び考察】

〈50rpm : pH1.2〉

標準製剤の平均溶出率が40%(10分)及び85%(45分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

最終比較時点(45分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

〈50rpm : pH4.0〉

標準製剤の平均溶出率が40%(10分)及び85%(60分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

最終比較時点(60分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

IV. 製剤に関する項目

<50rpm : pH6. 8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<100rpm : pH4. 0>

標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (60分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

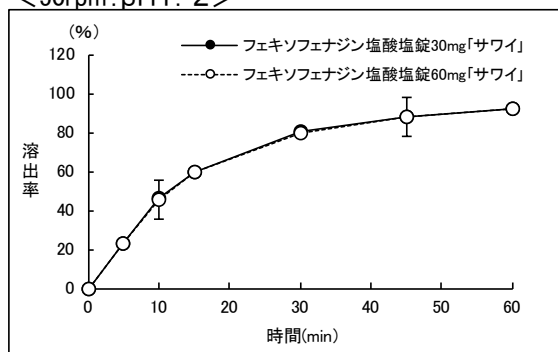
最終比較時点(60分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

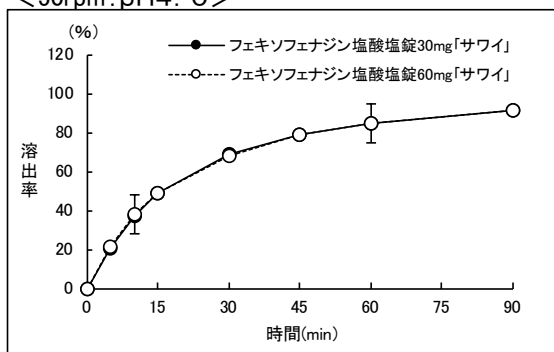
本剤の処方変更水準はB水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。

(溶出曲線)

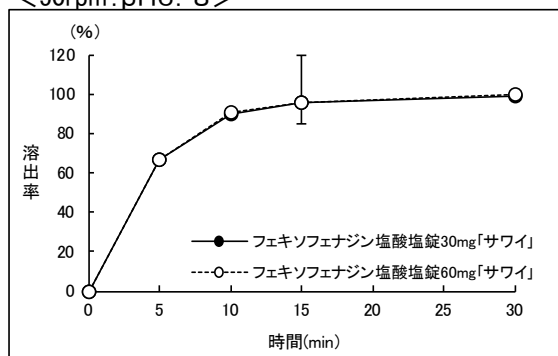
<50rpm:pH1. 2>



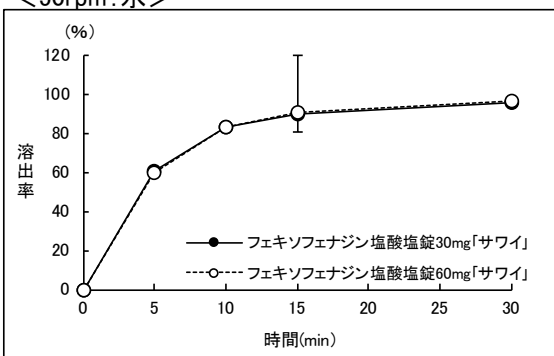
<50rpm:pH4. 0>



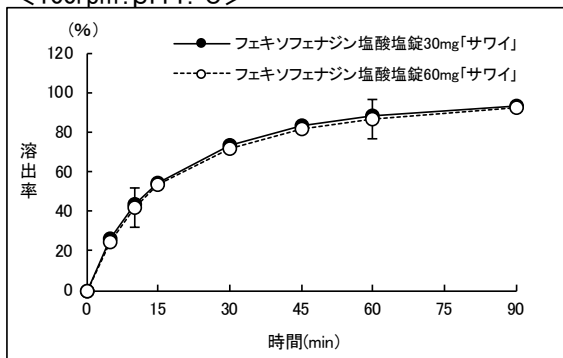
<50rpm:pH6. 8>



<50rpm:水>



<100rpm: pH4. 0>



([] : 判定基準の適合範囲)

●フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」^{16, 17)}

本剤は、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。

通知等	「後発医薬品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	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1. 2、4. 0、6. 8、水)、100rpm (pH4. 0)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1. 2>

標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (60分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

<50rpm : pH4. 0>

標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (90分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

<50rpm : pH6. 8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

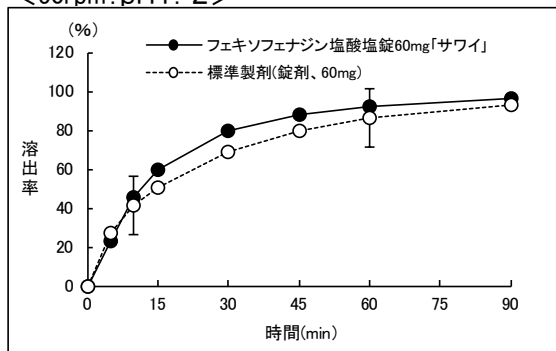
<100rpm : pH4. 0>

標準製剤の平均溶出率が40% (5分) 及び85% (60分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

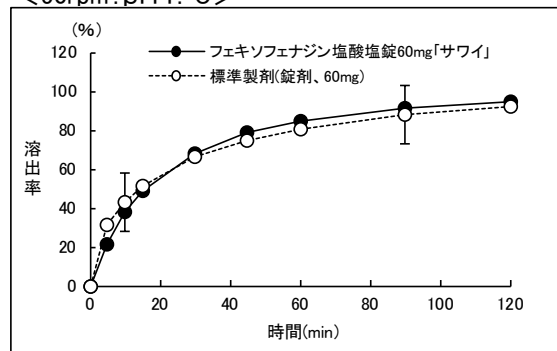
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

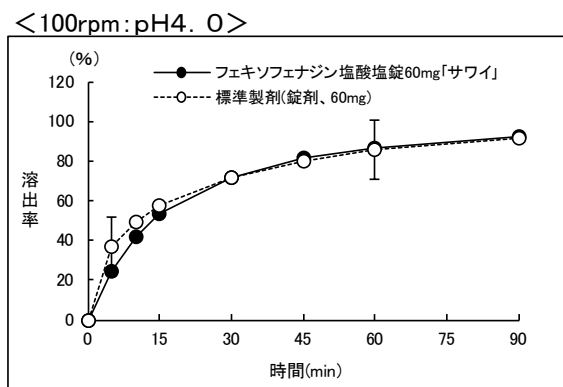
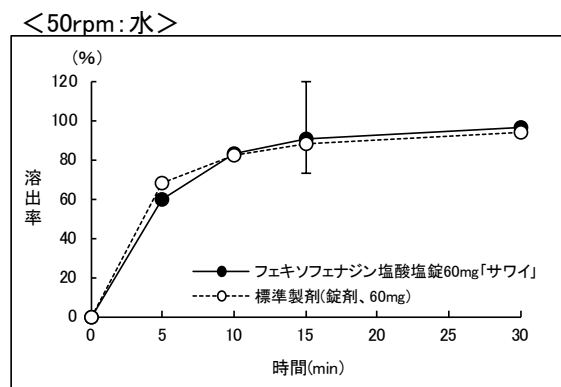
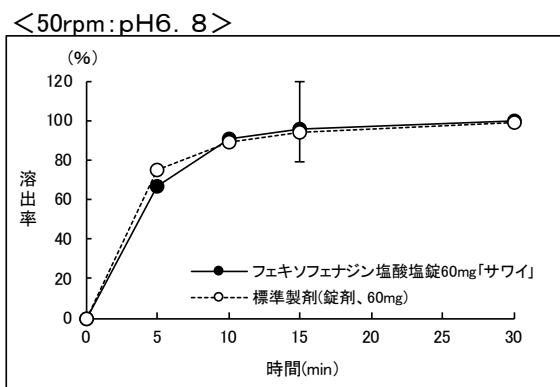
<50rpm: pH1. 2>



<50rpm: pH4. 0>



IV. 製剤に関する項目



([] : 判定基準の適合範囲)

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」¹⁸⁾

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1. 2、5. 0、6. 8、水)、100rpm (pH5. 0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」	
標準製剤	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1. 2>

標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 8\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(120分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 20\%$ の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : pH5. 0>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 8\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(360分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 20\%$ の範囲を超えるものがなかった。

IV. 製剤に関する項目

<50rpm : pH6. 8>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 8\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(360分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 20\%$ の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : 水>

標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(300分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(300分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

<100rpm : pH5. 0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

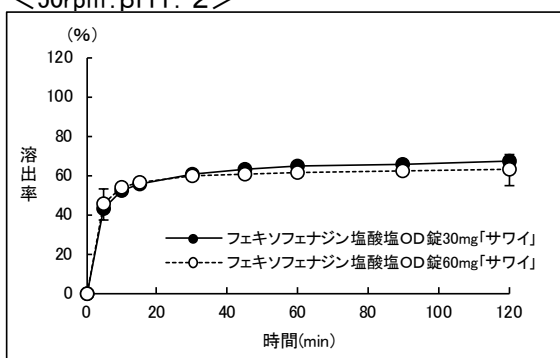
最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

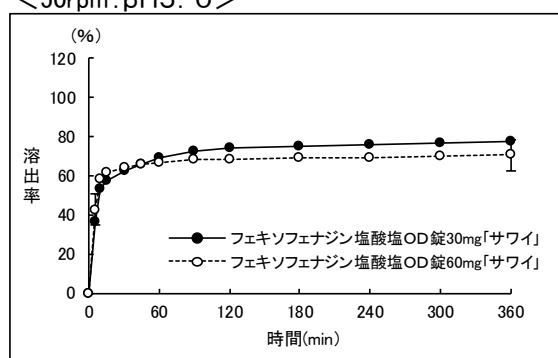
本剤の処方変更水準はA水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。

(溶出曲線)

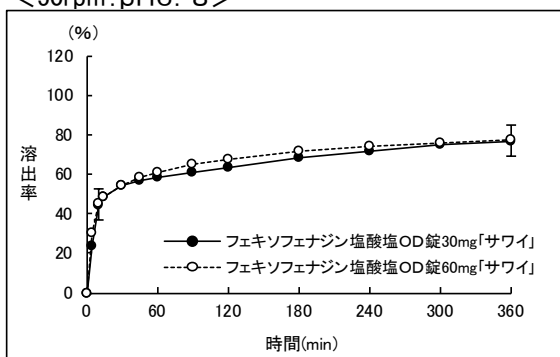
<50rpm:pH1. 2>



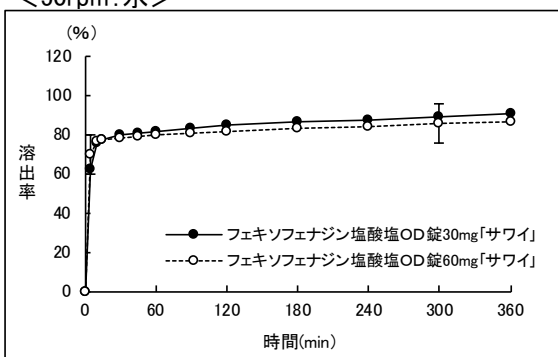
<50rpm:pH5. 0>



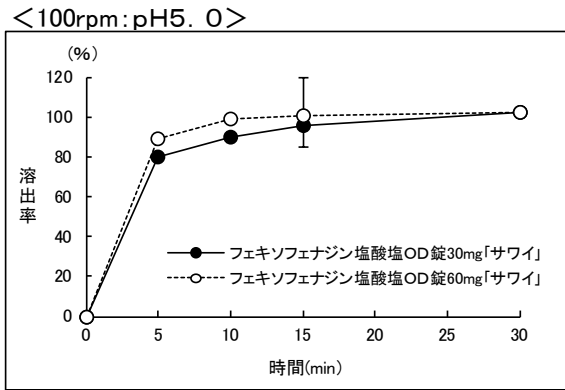
<50rpm:pH6. 8>



<50rpm:水>



IV. 製剤に関する項目



([] : 判定基準の適合範囲)

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」¹⁹⁾

通知等	「後発医薬品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	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm (pH6.8)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1. 2>

両製剤の溶出挙動に差異が認められた。

<50rpm : pH5. 0>

f 2 関数の値が46以上であった。

<50rpm : pH6. 8>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。

<50rpm : 水>

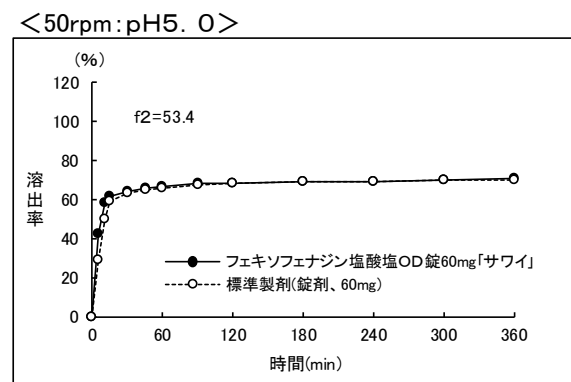
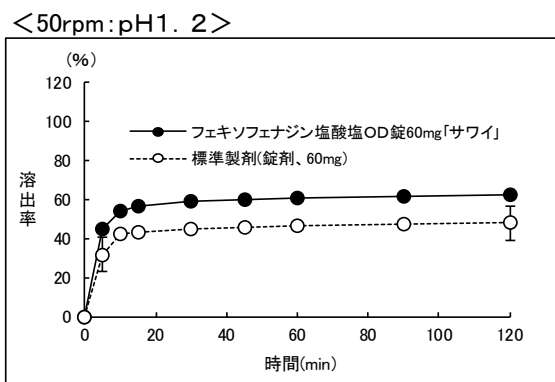
標準製剤の平均溶出率が40% (5分)及び85% (300分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

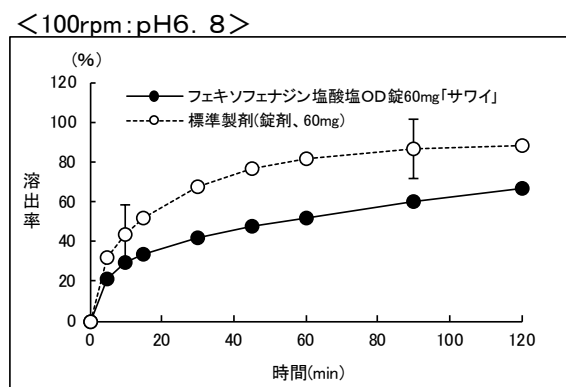
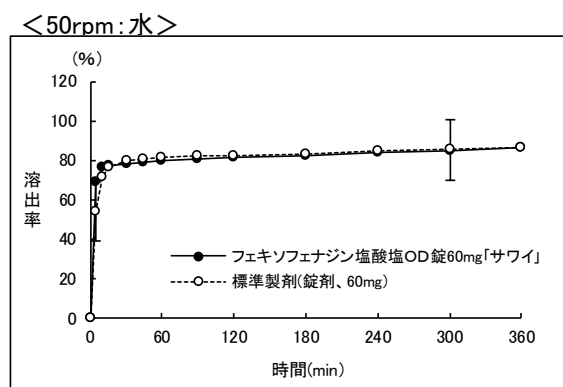
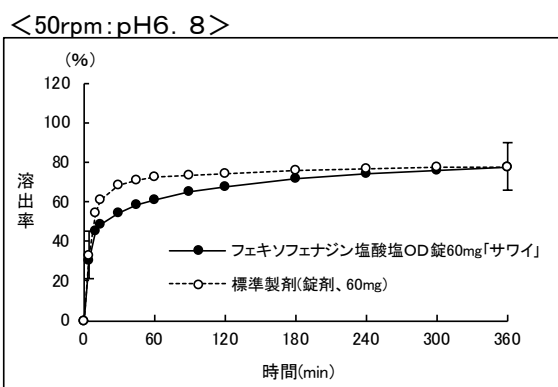
<100rpm : pH6. 8>

両製剤の溶出挙動に差異が認められた。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していないと判断した。しかしながら血中濃度比較試験において同等であることが確認されたため、両製剤は生物学的に同等であると判断した。

(溶出曲線)





([] : 判定基準の適合範囲)

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg/錠60mg「サワイ」
日局「フェキソフェナジン塩酸塩錠」の確認試験に準ずる。(紫外可視吸光度測定法)
- フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg/OD錠60mg「サワイ」
紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

- フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg/錠60mg「サワイ」
日局「フェキソフェナジン塩酸塩錠」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)
- フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg/OD錠60mg「サワイ」
液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

IV. 製剤に関する項目

12. 混入する可能性のある夾雑物
該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報
該当資料なし

14. その他
該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 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

2. 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。

<用法及び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)

3. 臨床成績

フェキソフェナジン塩酸塩製剤の臨床試験成績が以下のとおり報告されている。

1) 臨床データパッケージ

該当しない

2) 臨床効果

大規模なプラセボ対照RCTにおいて、プラセボとの有意差が認められ、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹でも効果が証明されている。⁴⁾

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) 無作為化並行用量反応試験

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

V. 治療に関する項目

(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. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群……………

オロパタジン塩酸塩、ロラタジン、エピナスチン塩酸塩等

2. 薬理作用……………

フェキソフェナジン塩酸塩の薬理作用について以下のとおり報告されている。

1) 作用部位・作用機序

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。

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

作用発現時間：服用後 1 hr⁴⁾

VII. 薬物動態に関する項目

フェキソフェナジン塩酸塩製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

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

VII. -1. -3) 参照

3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

●フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」¹⁵⁾

フェキソ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、フェキソ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。(IV. -7. 参照)

●フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」^{17, 20)}

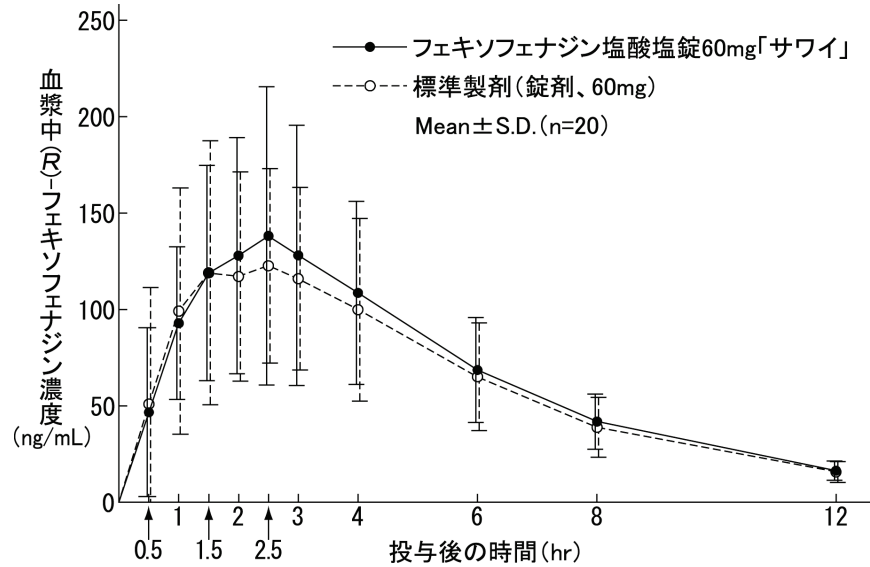
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
採血時点	0、0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

フェキソ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、Cmax)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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-12hr} (ng·hr/mL)
フェキソ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.)



●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」¹⁸⁾

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、フェキソフェナジン塩酸塩OD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。(IV. -7. 参照)

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」^{21, 22)}

通知等	「後発医薬品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
採血時点	0、0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

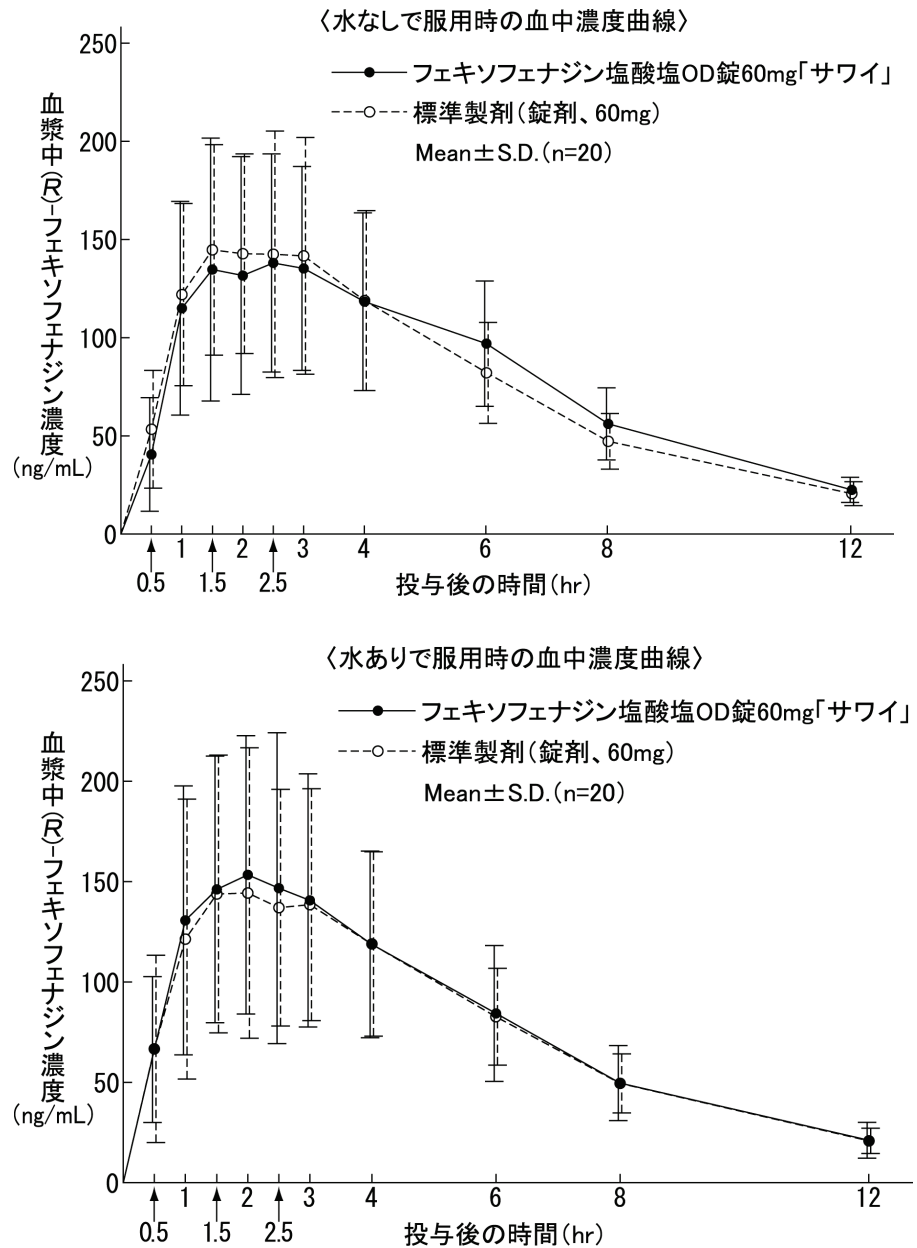
フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(フェキソフェナジン塩酸塩として60mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中(R)-フェキソフェナジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (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
	標準製剤(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
	標準製剤(錠剤、60mg)	164.8±72.4	2.0±1.0	3.1±0.7	945.7±323.5

(Mean±S.D.)

VII. 薬物動態に関する項目



血漿中濃度ならびに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。

4) 中毒域

該当資料なし

5) 食事・併用薬の影響

VIII. -7. 参照

健康成人男子(外国人)にクロスオーバー法で、空腹時及び食後(高脂肪食)にフェキソフェナジン塩酸塩錠120mgを単回経口投与時、空腹時に比べ食後投与時のAUC^{0-∞}及び最高血漿中濃度はそれぞれ15%及び14%減少した。¹⁾

(注)本剤の承認されている用法・用量はV. -2. を参照すること。

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

1) 解析方法

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

VII. -1. -3) 参照

4) 消失速度定数

● フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」を健康成人男子に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した場合の(R)-フェキソフェナジンの消失速度定数^{17,20)}
 $0.233 \pm 0.035 \text{hr}^{-1}$

● フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」を健康成人男子に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した場合の(R)-フェキソフェナジンの消失速度定数^{21,22)}

[水なし] $0.240 \pm 0.031 \text{hr}^{-1}$ 、[水あり] $0.228 \pm 0.045 \text{hr}^{-1}$

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

13~7,359ng/mLの濃度範囲で60~82%(69.4±5.9%)であった。¹⁾

3. 吸収

経口投与後消化管から速やかに吸収される。³⁾

4. 分布

1) 血液-脳関門通過性

血液脳関門を通過しないと考えられる。³⁾

2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

3) 乳汁への移行性

<参考>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。

VII. 薬物動態に関する項目

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

ほとんど代謝されない。⁴⁾

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

経口投与後48hrまでの尿中未変化体排泄率は11%、糞中は80%である。⁴⁾

2) 排泄率

VII. -6. -1) 参照

3) 排泄速度

VII. -6. -1) 参照

7. トランスポーターに関する情報

VIII. -7. 参照

8. 透析等による除去率

血液透析によって除去できない。

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……………
該当項目なし

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)……………

【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. 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……………
V. -2. 参照

5. 慎重投与内容とその理由……………
該当項目なし

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法……………

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。

7. 相互作用……………

1) 併用禁忌とその理由

該当項目なし

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
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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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	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。

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) 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。

3) その他の副作用

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、そう痒、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)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) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

フェキシソフェナジン塩酸塩製剤の副作用が以下のとおり報告されている。

副作用発現率は15.6%(1,127/7,212)であり、主な副作用は頭痛4.6%、眠気2.2%、嘔気1.2%等であった。²⁾

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

【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

副作用

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) その他の副作用

	頻度不明
過 敏 症 <small>注1)</small>	血管浮腫、そう痒、蕁麻疹、潮紅、発疹

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。

9. 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。

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。]

11. 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)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルギー皮膚内反応を抑制するため、アレルギー皮膚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。

13. 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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

14. 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) 本剤は舌の上へ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。

15. その他の注意

該当項目なし

16. その他

IX. 非臨床試験に関する項目

フェキソフェナジン塩酸塩の非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

1. 薬理試験……………
 - 1) 薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)

 - 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
変異原性試験
細菌を用いた復帰突然変異試験、CHO/HGPRTを用いた遺伝子突然変異試験、ラットリンパ球を用いた染色体異常試験の結果、変異原性はみられなかった(*in vitro*)。また、マウス骨髄細胞を用いた小核試験においても変異原性は認められなかった(*in vivo*)。³⁾

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

	規制区分
製剤	該当しない
有効成分	該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

3. 貯法・保存条件

- フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg/錠60mg「サワイ」
室温保存
- フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg/OD錠60mg「サワイ」
室温保存(開封後は湿気を避けて保存すること)

4. 薬剤取扱い上の注意点

1) 薬局での取扱い上の留意点について

特になし

2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

くすりのしおり：有り

VIII. -14. 参照

3) 調剤時の留意点について

特になし

5. 承認条件等

該当しない

6. 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

7. 容器の材質

●フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]ポリエチレンフィルム

●フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]ポリエチレンフィルム

バラ：[本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリプロピレン

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

バラ：[本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分：アレグラ錠30mg/錠60mg/OD錠60mg

同効薬：オロパタジン塩酸塩、ロラタジン、エピナスチン塩酸塩等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

●フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2013年8月15日、承認番号：22500AMX01499000

●フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2013年8月15日、承認番号：22500AMX01500000

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2013年8月15日、承認番号：22500AMX01545000

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2013年8月15日、承認番号：22500AMX01546000

X. 管理的事項に関する項目

11. 薬価基準収載年月日
2013年12月13日

12. 効能又は効果追加、用法及び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. 投薬期間制限医薬品に関する情報
本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

品名	HOT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
フェキソフェナジン塩酸塩 錠30mg「サワイ」	122965301	4490023F2276	622296501
フェキソフェナジン塩酸塩 錠60mg「サワイ」	122966001	4490023F1270	622296601
フェキソフェナジン塩酸塩 OD錠30mg「サワイ」	122963901	4490023F4066	622296301
フェキソフェナジン塩酸塩 OD錠60mg「サワイ」	122964601	4490023F3108	622296401

17. 保険給付上の注意
本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI . 文献

1. 引用文献
- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編, 第十六改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2011, C-3867-C-3871.
 - 2) JAPAN DRUGS編集委員会編, JAPAN DRUGS 日本医薬品総覧, 2008~2009年版, メディカルレビュー社, 2008, p. 1531-1532.
 - 3) American Society of Health-System Pharmacists, AHFS Drug Information, 2011, p. 34-39.
 - 4) 平田純生他編, 透析患者への投薬ガイドブック 慢性腎臓病(CKD)の薬物療法, 改訂2版, じほう, 2009, p. 265.
 - 5)~14) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]
 - 15)~16) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
 - 17) 田中孝典他, 新薬と臨牀, 62(9), 1645(2013).
 - 18)~19) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
 - 20)~21) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]
 - 22) 佐竹一夫他, 新薬と臨牀, 62(9), 1633(2013).
2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

