

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2008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「FFP」 フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」

Fexofenadine Hydrochloride Tablets 30mg・60mg「FFP」

アレルギー性疾患治療剤

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠 60mg「FFP」

(フェキソフェナジン塩酸塩口腔内崩壊錠)

Fexofenadine Hydrochloride OD Tablets 60mg「FFP」

剤形	フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」： フィルムコーティング錠（うすいだい色） フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」： フィルムコーティング錠（うすいだい色） フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg「FFP」：素錠 （白色の割線入り）
製剤の規制区分	該当なし
規格・含量	フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」： 1錠中に日局 フェキソフェナジン塩酸塩 30.0mg 含有する。 フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」： 1錠中に日局 フェキソフェナジン塩酸塩 60.0mg 含有する。 フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg「FFP」： 1錠中に日局 フェキソフェナジン塩酸塩 60.0mg 含有する。
一般名	和名：フェキソフェナジン塩酸塩(JAN) 洋名：Fexofenadine Hydrochloride(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 発売年月日	製造販売承認年月日：2013年 2月 15日 薬価基準収載年月日：2013年 6月 21日 発売年月日：2013年 6月 21日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：共創未来ファーマ株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室 TEL 050-3383-3846 医療関係者向けホームページ http://www.kyosomirai-p.co.jp/medical/top.html

本IFは2019年2月作成（第1版）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.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

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、I F と略す）の位置付け並びに I F 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 I F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、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新たな I F 記載要領が策定された。

2. I F とは

I F 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 I F 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 I F 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。

[I F の様式]

- ①規格は A 4 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。
- ② I F 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「I F 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。

[I F の作成]

- ① I F 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。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの I F 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 2008」（以下、「I F 記載要領 2008」と略す）により作成された I F 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。

[I F の発行]

- ① 「 I F 記載要領 2008 」 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、「 I F 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 I F が改訂される。

3. I F の利用にあたって

「 I F 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、 P D F 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 I T 環境によっては必要に応じて M R 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 I F 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、 I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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、 I F 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、 I F 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、 I F 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

I F 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。 I F 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、 I F 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
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名（命名法）	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 物理化学的性質	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4
3. 有効成分の確認試験法	4
4. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	6
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6
4. 製剤の各種条件下における安定性	6
5. 調整法及び溶解後の安定性	8
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	8
7. 溶出性	9
8. 生物学的試験法	16
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	16
10. 製剤中の有効成分の定量法	16
11. 力価	17
12. 混入する可能性のある夾雑物	17
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	17
14. その他	17
V. 治療に関する項目	18
1. 効能又は効果	18
2. 用法及び用量	18
3. 臨床成績	18
VI. 薬効薬理に関する項目	20
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	20
2. 薬理作用	20
VII. 薬物動態に関する項目	22
1. 血中濃度の推移、測定法	21
2. 薬物速度論的パラメータ	24
3. 吸収	25
4. 分布	25
5. 代謝	25
6. 排泄	25
7. 透析等による除去率	26
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	27

1. 警告内容とその理由	27
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	27
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	27
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	27
5. 慎重投与内容とその理由	27
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	27
7. 相互作用	27
8. 副作用	28
9. 高齢者への投与	29
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	29
11. 小児等への投与	29
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	29
13. 過量投与	29
14. 適用上の注意	29
15. その他の注意	30
16. その他	30
IX. 非臨床試験に関する項目	31
1. 薬理試験	31
2. 毒性試験	31
X. 管理的事項に関する項目	32
1. 規制区分	32
2. 有効期間又は使用期限	32
3. 貯法・保存条件	32
4. 薬剤取扱い上の注意点	32
5. 承認条件等	32
6. 包装	32
7. 容器の材質	32
8. 同一成分・同効薬	32
9. 国際誕生年月日	33
10. 製造・販売承認年月日及び承認番号	33
11. 薬価基準収載年月日	33
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	33
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	33
14. 再審査期間	33
15. 投与期間制限医薬品に関する情報	33
16. 各種コード	33
17. 保険給付上の注意	33
X I. 文献	34
1. 引用文献	34
2. その他の参考文献	34
X II. 参考資料	35
1. 主な外国での発売状況	35
2. 海外における臨床支援情報	35
X III. 備考	36
その他の関連資料	36

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

フェキソフェナジンは、アレルギー性疾患治療剤であり、本邦では2000年に上市されている。フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」・フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」・フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg「FFP」は富士フイルムファーマ株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2013 年 2 月に承認を得て、2013 年 6 月より製造・販売を行っている。2019 年 2 月より共創未来ファーマ株式会社が製造販売承認を承継し、製造・販売を行っている。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1)本剤は選択的ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用と共に、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し、アレルギー症状を緩和する薬剤である。
- 2)フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg「FFP」は唾液のみで服用できる口腔内崩壊錠である。
- 3)重大な副作用としてショック、アナフィラキシー様症状、肝機能障害、黄疸、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（頻度不明）。

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 「FFP」
- フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」
- フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」

(2)洋名

- Fexofenadine Hydrochloride Tablets 30mg 「FFP」
- Fexofenadine Hydrochloride Tablets 60mg 「FFP」
- Fexofenadine Hydrochloride OD Tablets 60mg 「FFP」

(3)名称の由来

- 一般名+剤形+規格(含量)+「FFP」
- 薬食審査発第 0922001 号(平成 17 年 9 月 22 日)に基づく

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)

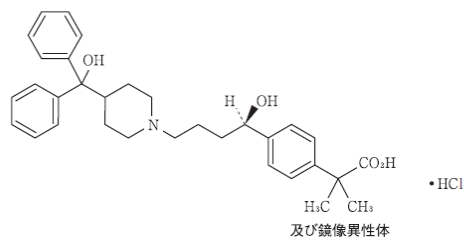
Fexofenadine Hydrochloride (JAN)

(3)ステム

不明

3. 構造式又は示性式

構造式:



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-{(1RS)-1-Hydroxy-4-[4-(hydroxydiphenylmethyl) piperidin-1-yl]butyl}phenyl)-2-methylpropanoic acid monohydrochloride

II. 名称に関する項目

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

7. CAS 登録番号

138452-21-8

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

メタノールにきわめて溶けやすく、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

該当資料なし

(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

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

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

(1) 各種条件下における安定性

該当資料なし

(2) 強制分解による生成物

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法
- 3) 塩化物の定性反応

4. 有効成分の定量法

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、規格及び性状

剤形の区別

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「FFP」：フィルムコーティング錠

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」：フィルムコーティング錠

フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」：割線入りの素錠










規格

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「FFP」：1錠中に日局 フェキソフェナジン塩酸塩 30.0mg 含有する。

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」：1錠中に日局 フェキソフェナジン塩酸塩 60.0mg 含有する。

フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」：1錠中に日局 フェキソフェナジン塩酸塩 60.0mg 含有する。

性状：

	色・剤形	外形			サイズ			識別コード
		表面	裏面	側面	直径 (mm)	重量 (mg)	厚さ (mm)	
フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「FFP」	うすいだいたい色のフィルムコーティング錠				約 6.5	約 104	約 3.3	FF 133
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」	うすいだいたい色のフィルムコーティング錠				約 8.5	約 206	約 4.1	FF 134
フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」	白色の割線入りの素錠				約 9.5	約 330	約 4.3	FF 147

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「FFP」：FF133

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」：FF134

フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」：FF147

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

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「FFP」：1錠中に日局 フェキソフェナジン塩酸塩 30.0mg 含有する。

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」：1錠中に日局 フェキソフェナジン塩酸塩 60.0mg 含有する。

フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg「FFP」：1錠中に日局 フェキソフェナジン塩酸塩 60.0mg 含有する。

(2)添加物

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」：

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

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」：

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

フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg「FFP」：

D-マンニトール、タルク、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、アンモニオアルキルメタクリレートコポリマー分散液、結晶セルロース、クロスポビドン、カルメロース、含水二酸化ケイ素、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、アセスルファミウムカリウム、フマル酸ステアリルナトリウム、1-メントール、香料

(3)その他

該当しない

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¹⁾

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」は、最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、室温保存において 3 年間安定であることが推測された。

IV. 製剤に関する項目

<加速試験>

試験条件：最終包装製品（PTP包装）の状態、40±1℃、75±5%R.H.

試験方法	保存条件	保存状態	試験項目	経過年月	
				開始時	6箇月後
加速試験	40±1℃、 75±5%R.H.	PTP包装品	性状 うすいだい色のフィルム コーティング錠	うすいだい だい色の フィルム コーティ ング錠	変化なし
			確認試験 紫外可視吸光度測定法 257nm～261nm 極大を示す	適合	適合
			製剤均一性* 判定値:15.0%を超えない	1.15～ 2.38%	—
			溶出性 パドル法 50回転、 試験液 0.001mol/L 塩酸試液 30分間の溶出率が75%以上	97.8～ 101.8%	92.0～ 102.3%
			定量試験 フェキソフェナジン塩酸塩 95.0～105.0%	100.61～ 100.86%	100.99～ 101.28%

※製剤均一性については、安定性の評価に関与しないため、開始時のみ実施し、1、3及び6箇月後は実施しなかった。

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」は、最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6ヵ月）の結果、室温保存において3年間安定であることが推測された。

<加速試験>

試験条件：最終包装製品（PTP包装）の状態、40±1℃、75±5%R.H.

試験方法	保存条件	保存状態	試験項目	経過年月	
				開始時	6箇月後
加速試験	40±1℃、 75±5%R.H.	PTP包装品	性状 うすいだい色のフィルム コーティング錠	うすいだい だい色の フィルム コーティ ング錠	変化なし
			確認試験 紫外可視吸光度測定法 257nm～261nm 極大を示す	適合	適合
			製剤均一性* 判定値:15.0%を超えない	1.00～ 2.57%	—

IV. 製剤に関する項目

			溶出性 パドル法 50回転, 試験液 0.001mol/L 塩酸試液 30分間の溶出率が75%以上	97.5~ 104.8%	94.6~ 103.0%
			定量試験 フェキソフェナジン塩酸塩 95.0~105.0%	102.08~ 102.40%	101.52~ 101.98%

※製剤均一性については、安定性の評価に関与しないため、開始時のみ実施し、1、3及び6箇月後は実施しなかった。

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠 60mg「FFP」

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠 60mg「FFP」は、最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、室温保存において3年間安定であることが推測された。

<加速試験>

試験条件：最終包装製品（PTP包装）の状態、40±1℃、75±5%R.H.

試験方法	保存条件	保存状態	試験項目	経過年月	
				開始時	6箇月後
加速試験	40±1℃、 75±5%R.H.	PTP 包装品	性状 白色の割線入り素錠	白色の割線 入り素錠	変化なし
			確認試験 紫外可視吸光度測定法 257nm~261nm 極大を示す	適合	適合
			製剤均一性* 判定値:15.0%を超えない	0.67~ 2.54%	—
			崩壊性 試料の残留物をガラス管内に全 く認めない。	適合	適合
			溶出性 パドル法 50回転, 試験液 水 30分間の溶出率が70%以上	98.0~ 102.8%	94.0~ 102.2%
			定量試験 フェキソフェナジン塩酸塩 95.0~105.0%	99.21~ 100.39%	99.37~ 100.09%

※製剤均一性については、安定性の評価に関与しないため、開始時のみ実施し、1、3及び6箇月後は実施しなかった。

5. 調整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²⁾

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」

1)フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」の公的溶出規格への適合

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」は、日本薬局方医薬品各条に定められた溶出規格（水 50rpm で 30 分間の溶出率は 80%以上）に適合していることが確認されている。

2)フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」の溶出挙動における類似性

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」とフェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」の溶出挙動の類似性を検討するため、溶出試験を実施した。

試験製剤：フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」

標準製剤：フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」

なお、標準製剤は同時申請品目であり、ヒト試験において先発医薬品と生物学的に同等であることが判断された製剤である。

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

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

試験方法：後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン

試験条件：

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH4.0 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8 日本薬局方溶出試験第 2 液

水 日本薬局方精製水

回転数：50 回転（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）、100 回転（pH4.0）

(1) 平均溶出率

ガイドラインの判定基準のうち、次の基準に従って類似性を判定した。

<判定基準>

【pH1.2 (50rpm)】

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。

【pH4.0 (50rpm)】

標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

試験製剤が規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が 40%および 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤平均溶出率±10%の範囲にあるか、または f 2 関数の値は 50 以上である。

【pH6.8 (50rpm)】

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

標準製剤の平均溶出率が約 60%及び 85%となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。

【水 (50rpm)】

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

IV. 製剤に関する項目

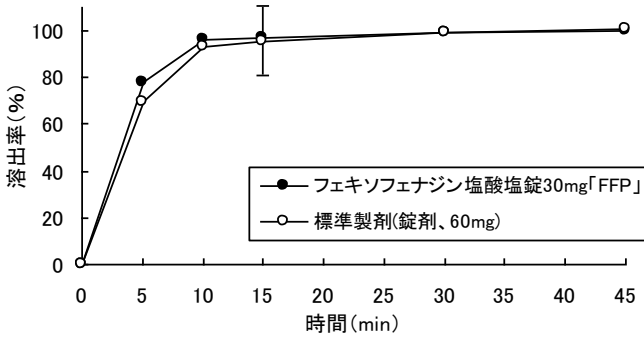
試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にある。

【pH4.0 (100rpm)】

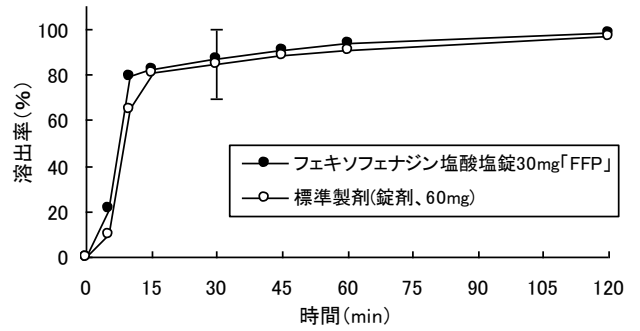
標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にある。

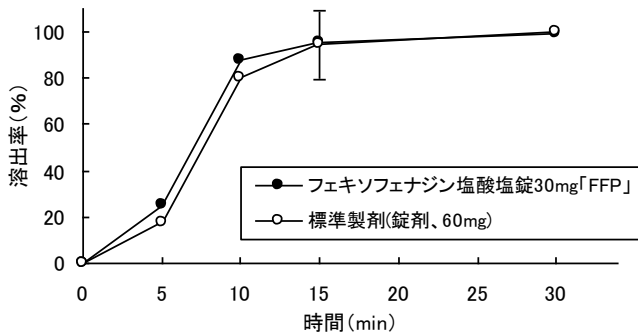
【pH1.2、50rpm】



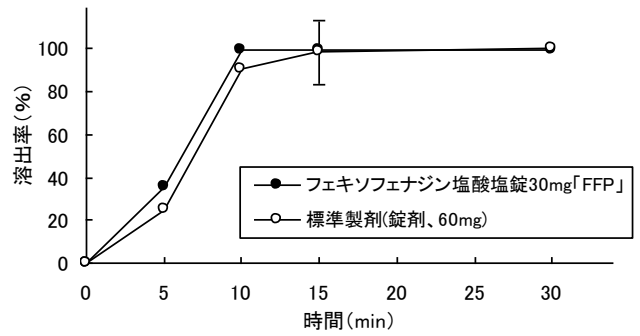
【pH4.0、50rpm】



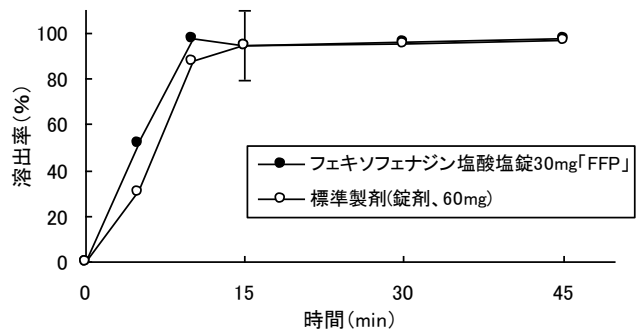
【pH6.8、50rpm】




【水、50rpm】



【pH4.0、100rpm】



※判定ポイントにおける標準製剤の平均溶出率の $\pm 15\%$ の範囲を  で示す。

IV. 製剤に関する項目

表：溶出挙動における類似性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件			標準製剤 (錠剤、60mg)	フェキソフェナジン塩 酸塩錠 30mg「FFP」	判定
回転数	試験液	採取時間	平均溶出率%	平均溶出率%	
50rpm	pH1.2	15分	95.74	97.00	適合
	pH4.0	30分	84.88	86.91	適合
	pH6.8	15分	94.40	95.58	適合
	水	15分	98.48	99.92	適合
100rpm	pH4.0	15分	94.68	94.46	適合

(2) 個々の溶出率

各試験条件の最終比較時点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が pH4.0 (50rpm) では±12%、それ以外の試験液では±15%の範囲を超えるものが無かった。

上記 (1) 及び (2) の両基準を満たしていたため、標準製剤と試験製剤の溶出率は同等であると判断された。

結論

「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」に従い、フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」と標準製剤の類似性を検討するために試験を行った結果、両製剤の溶出挙動は同等であると判断されたため、両製剤は生物学的に同等であると判断した。

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」

1)フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」の公的溶出規格への適合

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」は、日本薬局方医薬品各条に定められた溶出規格（水 50rpm で 30 分間の溶出率は 80%以上）に適合していることが確認されている。

2)フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」の溶出挙動における類似性

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 日付薬食審査発第 1124004 号

試験製剤：フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」

標準製剤：フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 錠剤

試験方法：溶出試験法のパドル法

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH4.0 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8 日本薬局方溶出試験第 2 液

水 日本薬局方精製水

回転数：50 回転（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）、100 回転（pH1.2）

IV. 製剤に関する項目

判定基準：

ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って類似性を判定した。

【pH1.2 (50rpm)】

標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が 40%および 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 \pm 15%の範囲にあるか、又は t_2 関数の値は 42 以上である。

【pH4.0 (50rpm)】

標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が 40%および 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 \pm 15%の範囲にあるか、又は t_2 関数の値は 42 以上である。

【pH6.8 (50rpm)】

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 \pm 15%の範囲にある。

【水 (50rpm)】

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

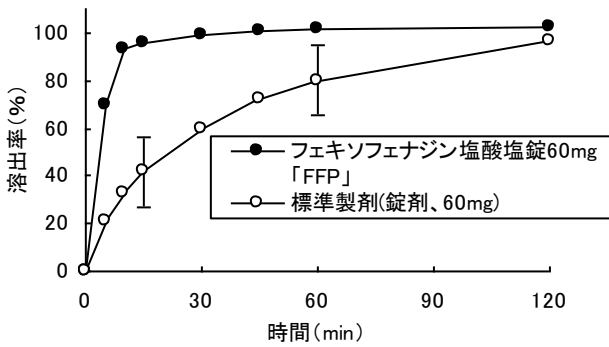
試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 \pm 15%の範囲にある。

【pH1.2 (100rpm)】

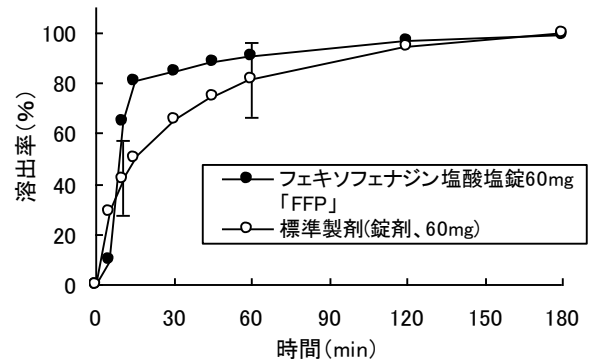
標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が 40%および 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 \pm 15%の範囲にあるか、又は t_2 関数の値は 42 以上である。

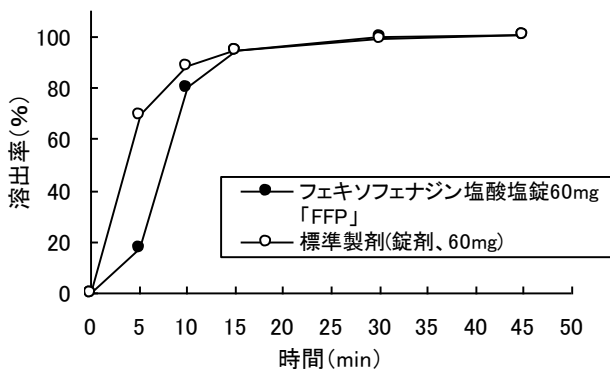
【pH1.2、50rpm】



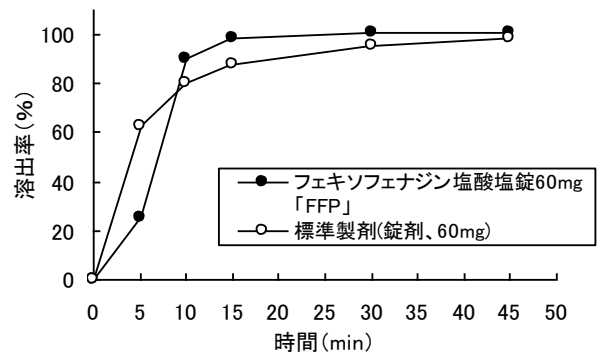
【pH4.0、50rpm】



【pH6.8、50rpm】

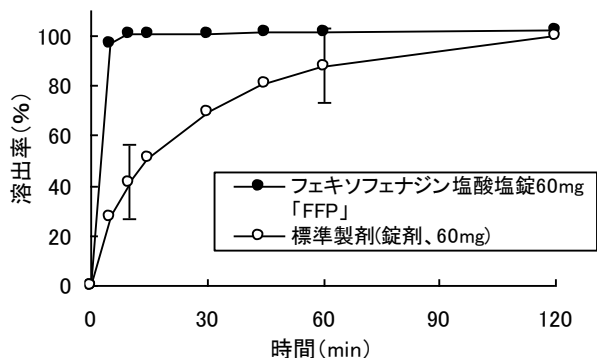


【水、50rpm】



IV. 製剤に関する項目

【pH1.2、100rpm】



表：溶出挙動における類似性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件			標準製剤 (錠剤、60mg)	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」	F2 関数	判定
回転数	試験液	採取時間	平均溶出率%	平均溶出率%		
50rpm	pH1.2	15分	41.66	95.74	21.1	不適合
		60分	80.18	101.56		
	pH4.0	10分	42.25	65.18	35.2	不適合
		60分	81.62	91.12		
pH6.8	15分	94.87	94.40	—	適合	
	水	15分	87.68	98.48	—	適合
100rpm	pH1.2	10分	41.55	101.13	24.9	不適合
		60分	88.20	101.52		

結論

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに従い、フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」と標準製剤の類似性を検討するために試験を行った結果、試験液 pH6.8 及び試験液水で溶出挙動の類似性が認められたが、試験液 pH1.2 (50rpm)、試験液 pH4.0 及び試験液 pH1.2(100rpm)では類似性が認められなかった。標準製剤は試験液 pH6.8 で速やかに溶出するため、試験液 pH6.8 がもっとも重要な試験液であると考えられた。試験液 pH6.8 については、フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」及び標準製剤の溶出挙動の類似性が認められていることより、ヒトでの生物学的同等性試験においては同等の結果が得られるものと推察された。

IV. 製剤に関する項目

●フェキソフェナジン塩酸塩OD錠 60mg「FFP」の溶出挙動における類似性

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日付薬食審査発第1124004号

試験製剤：フェキソフェナジン塩酸塩 OD錠 60mg 「FFP」

標準製剤：フェキソフェナジン塩酸塩 60mg 口腔内崩壊錠

試験方法：溶出試験法のパドル法

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第1液

pH3.0 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8 日本薬局方溶出試験第2液

水 日本薬局方精製水

回転数：50回転（pH1.2、pH3.0、pH6.8、水）、100回転（pH6.8）

判定基準：

ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って類似性を判定した。

【pH1.2 (50rpm)】

標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%以上85%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、および規定された試験時間において試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が46以上である。

【pH3.0 (50rpm)】

標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%以上85%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、および規定された試験時間において試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が46以上である。

【pH6.8 (50rpm)】

標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が42以上である。

【水 (50rpm)】

標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が42以上である。

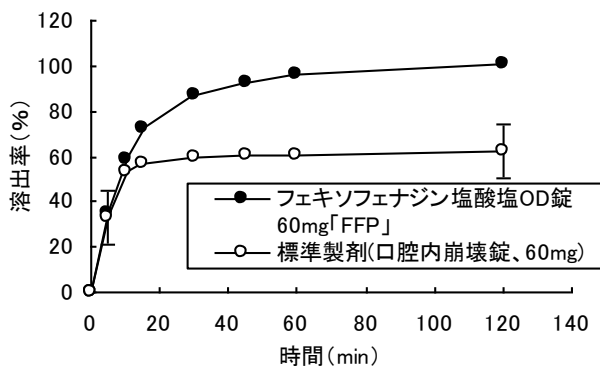
【pH6.8 (100rpm)】

標準製剤が15～30分以内に平均85%以上溶出する場合

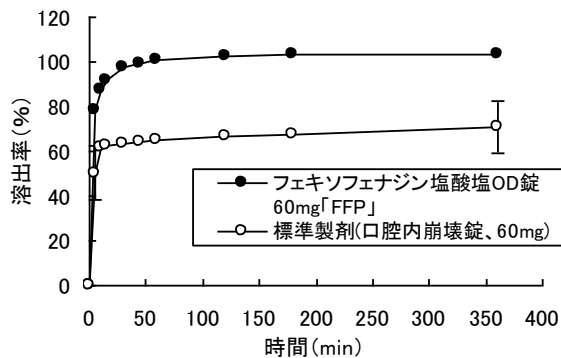
標準製剤の平均溶出率が60%および85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率が±15%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値は42以上である。

IV. 製剤に関する項目

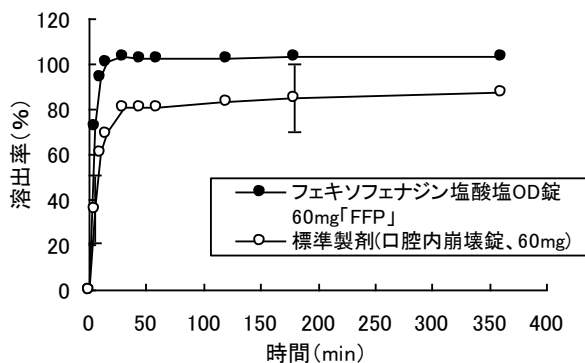
【pH1.2、50rpm】



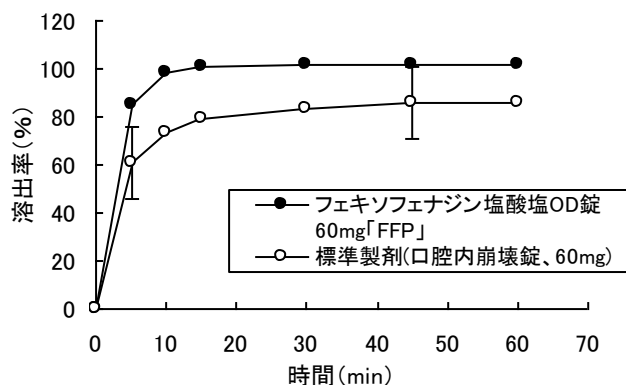
【pH3.0、50rpm】



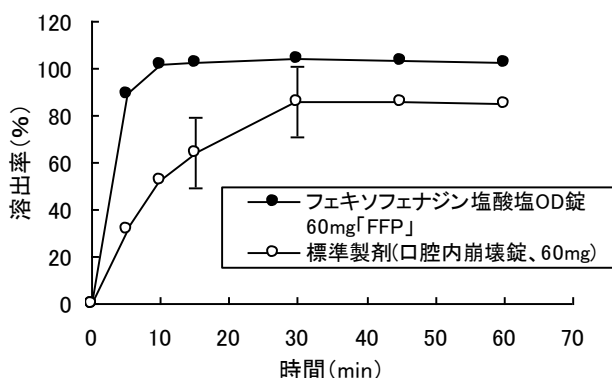
【pH6.8、50rpm】



【水、50rpm】



【pH6.8、100rpm】



表：溶出挙動における類似性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件			標準製剤 (口腔内崩壊錠、 60mg)	フェキソフェナジン 塩酸塩 OD 錠 60mg「FFP」	F2 関数	判定
回転数	試験液	採取時間	平均溶出率%	平均溶出率%		
50rpm	pH1.2	5分	33.25	34.41	75.6	適合
		120分	62.22	100.78		
	pH3.0	5分	50.39	78.54	30.6	不適合
		360分	70.91	103.23		
pH6.8	5分	35.52	72.65	34.9	不適合	
	180分	84.66	103.43			
水	5分	60.53	84.94	35.2	不適合	
	45分	85.54	101.58			
100rpm	pH6.8	15分	63.87	102.88	28.6	不適合
		30分	85.79	103.90		

IV. 製剤に関する項目

以上の結果より、pH1.2 試験液については類似性が認められたが、そのほかの試験液については類似性が認められなかった。

しかし、先発品のインタビューフォームより、試験製剤（フェキソフェナジン塩酸塩口腔内容崩壊錠）は、水なしで服用又は水とともに服用した場合のいずれにおいてもフェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg と生物学的に同等であることが確認されているため、今回類似性が認められなかった試験液について、フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg と生物学的同等性が認められたフェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」との類似性の確認を行った。

表：溶出挙動における類似性（フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」及びフェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」の平均溶出率の比較）

試験条件			平均溶出率%	
回転数	試験液	採取時間	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」	フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」
50rpm	pH3.0	15 分	94.68	91.52
	pH6.8	15 分	94.40	100.48
	水	15 分	98.48	100.83
100rpm	pH6.8	15 分	-	102.88

上記の通り、試験液 pH3.0 (50rpm)、試験液 pH6.8 (50rpm)、水 (50rpm) では両製剤共に 15 分以内に平均 85%以上溶出しており、類似性が認められた。

試験液 pH6.8(100rpm)については、フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」の試験結果が無いため比較できなかったが、試験液 pH6.8 (50rpm) が 15 分以内に 85%以上溶出していることから、試験液 pH6.8 (100rpm) についても 15 分以内に 85%以上溶出することが予測できる。フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」についても、15 分以内に平均 85%以上溶出しており、類似性が認められることが推測された。

結論

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに従い、フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」と標準製剤の類似性を検討するために試験を行った結果、試験液 pH1.2 では溶出挙動の類似性が認められたが、試験液 pH3.0 (50rpm)、試験液 pH6.8 (50rpm)、水 (50rpm) 及び試験液 pH6.8(100rpm)では類似性が認められなかった。

しかし、試験製剤は標準製剤（フェキソフェナジン塩酸塩口腔内崩壊錠）と生物学的に同等であると推察される標準製剤（フェキソフェナジン塩酸塩錠）とのヒトでの生物学的同等性が証明されたフェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」と類似性が認められたことより、標準製剤あるフェキソフェナジン塩酸塩口腔内崩壊錠と試験製剤であるフェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」の溶出挙動の差はヒトでの生物学的同等性試験においては、影響しない範囲であると考えられる。

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

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

11. 力価

該当しない

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

該当しない

14. その他

該当しない

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・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

(1)臨床データパッケージ

phase	対象	有効性	安全性	薬物動態	概要
生物学的同等性試験	日本人健康成人男子	評価対象外	評価資料あり	評価資料あり	2剤2期クロスオーバー法

(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

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
該当資料なし

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

ケトチフェンフマル酸塩、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、メキタジン、エメダスチンフマル酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン、レボセチリジン塩酸塩 等

2. 薬理作用

(1)作用部位・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_1 作用に拮抗することにより、アレルギー症状を緩和する。

(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

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

「VII.薬物動態に関する項目 1.(3)臨床試験で確認された血中濃度」を参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度³⁾

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」の溶出挙動における類似性

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「FFP」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」に従い、フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」と標準製剤としたとき、両製剤の溶出挙動は等しく、両製剤は生物学的に同等であると判断した。

「IV.製剤に関する項目 7.溶出性●フェキソフェナジン塩酸塩 30mg「FFP」2)フェキソフェナジン塩酸塩 30mg「FFP」の溶出挙動における類似性」を参照

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」

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 日付薬食審査発第 1124004 号

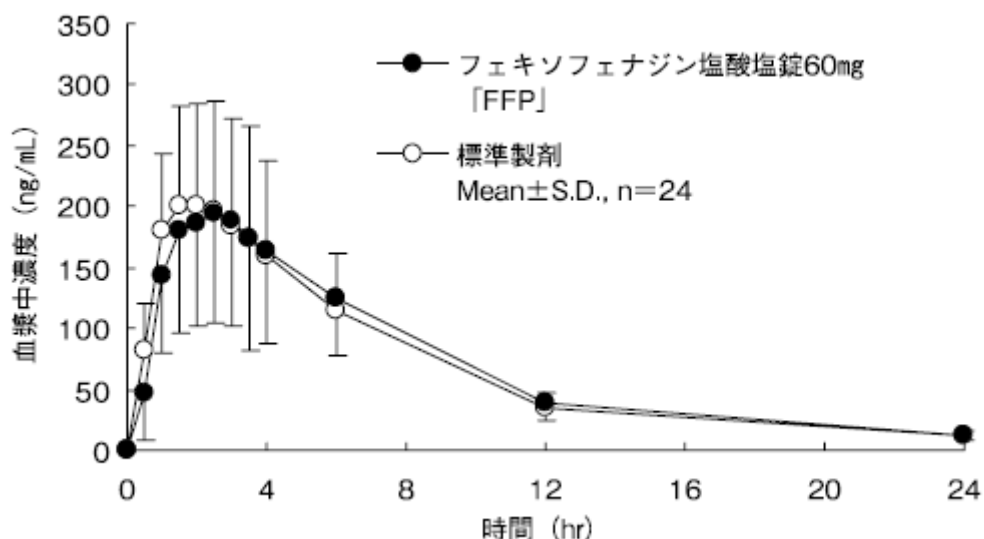
日本人健康成人男子 24 名に、フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」及び標準製剤（錠剤、60mg）を、それぞれ 1 錠（フェキソフェナジン塩酸塩として 60mg）絶食時単回経口投与し、7 日間以上の休薬期間をおいた 2 剤 2 期クロスオーバー法で両製剤の血漿中フェキソフェナジン未変化体濃度を比較検討した。なお、本臨床試験は「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（薬食審査発第 1124004 号、平成 18 年 11 月 24 日）に従って計画した。

その結果、フェキソフェナジンの平均血漿中濃度推移は以下に示したとおりで、血漿中濃度曲線下面積 AUC_{0-24} はフェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「FFP」が $1681 \text{ ng} \cdot \text{hr/mL}$ 、標準製剤が $1657 \text{ ng} \cdot \text{hr/mL}$ で、平均最高血漿中濃度到達時間 T_{max} はそれぞれ 2.4 時間、2.1 時間で、平均最高血漿中濃度 C_{max} はそれぞれ 234.4 ng/mL 、 225.7 ng/mL 、平均消失半減期 $t_{1/2}$ はそれぞれ 5.5 時間、5.5 時間と算出された。

得られた薬物動態パラメータをもとに 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、0～24 時間までの血漿中濃度曲線下面積 AUC_{0-24} は $\log(0.863) \sim \log(1.161)$ 、 C_{max} は $\log(0.831) \sim \log(1.245)$ であり、後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインが要求する $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であった。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-24} ($\text{ng} \cdot \text{hr/mL}$)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
フェキソフェナジン塩酸 塩錠 60mg「FFP」	1681±643	234.4±95.4	2.4±1.4	5.5±0.8
標準製剤 (錠剤、60mg)	1657±618	225.7±93.3	2.1±1.2	5.5±0.8

(Mean±S.D., n=24)



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。

●フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg「FFP」

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 日付薬食審査発第 1124004 号

1) 水で服用

日本人健康成人男子 30 名に、フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg「FFP」及び標準製剤（口腔内崩壊錠、60mg）を、それぞれ 1 錠（フェキソフェナジン塩酸塩として 60mg）絶食時、水 150mL とともに単回経口投与し、7 日間以上の休薬期間をおいた 2 剤 2 期クロスオーバー法で両製剤の血漿中フェキソフェナジン未変化体濃度を比較検討した。なお、本臨床試験は「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（薬食審査発第 1124004 号、平成 18 年 11 月 24 日）に従って計画した。

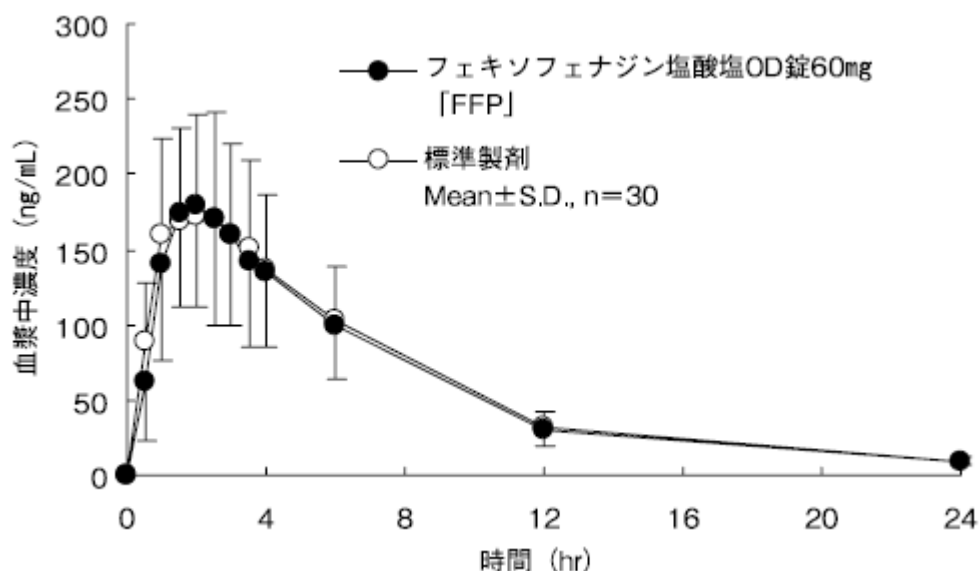
その結果、フェキソフェナジンの平均血漿中濃度推移は以下に示したとおりで、血漿中濃度曲線下面積 AUC₀₋₂₄ はフェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠が 1406ng・hr/mL で、標準製剤が 1462 ng・hr/mL で平均最高血漿中濃度到達時間 T_{max} はそれぞれ 2.1 時間、2.0 時間で、平均最高血漿中濃度 C_{max} はそれぞれ 201.1ng/mL、196.0ng/mL、平均消失半減期 t_{1/2} はそれぞれ 5.2 時間、5.1 時間と算出された。

得られた薬物動態パラメータをもとに 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、0～24 時間までの血漿中濃度曲線下面積 AUC₀₋₂₄ は log(0.850)～log(1.040)、C_{max} は log(0.848)～log(1.128)であり、後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインが要求する log(0.80)～log(1.25)の範囲内であった。

	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)
フェキソフェナジン塩酸塩 OD60mg「FFP」	1406±510	201.1±90.9	2.1±0.8	5.2±0.5
標準製剤 (口腔内崩壊錠、60mg)	1462±451	196.0±68.1	2.0±0.8	5.1±0.5

(Mean±S.D., n=30)

VII. 薬物動態に関する項目



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) 水なしで服用

日本人健康成人男子 30 名に、フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」及び標準製剤（口腔内崩壊錠、60mg）を、それぞれ 1 錠（フェキソフェナジン塩酸塩として 60mg）絶食時、水なしで舌の上で溶かし、唾液とともに 1 分以内に単回経口投与し、7 日間以上の休薬期間をおいた 2 剤 2 期クロスオーバー法で両製剤の血漿中フェキソフェナジン未変化体濃度を比較検討した。なお、本臨床試験は「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（薬食審査発第 1124004 号、平成 18 年 11 月 24 日）に従って計画した。

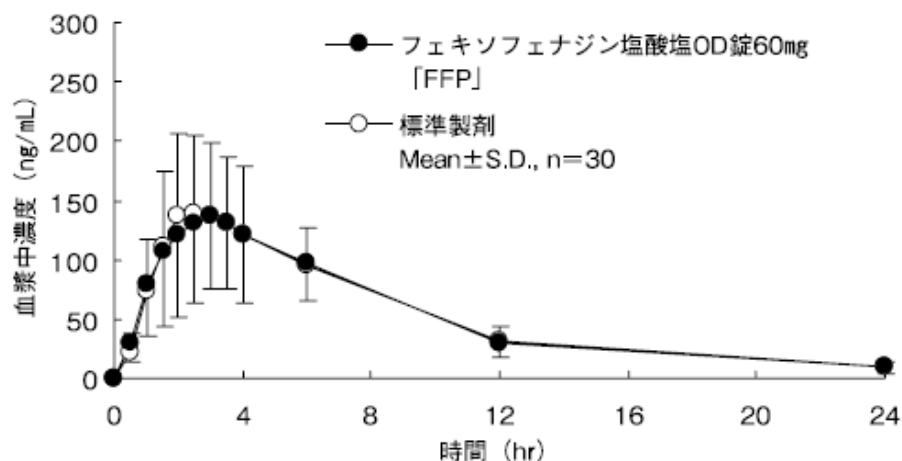
その結果、フェキソフェナジンの平均血漿中濃度推移は以下に示したとおりで、血漿中濃度曲線下面積 AUC₀₋₂₄ はフェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠が 1232ng・hr/mL で、標準製剤が 1255 ng・hr/mL で平均最高血漿中濃度到達時間 T_{max} はそれぞれ 2.5 時間で、2.8 時間で、平均最高血漿中濃度 C_{max} はそれぞれ 159.5ng/mL、158.9ng/mL、平均消失半減期 t_{1/2} はそれぞれ 5.4 時間、5.5 時間と算出された。

得られた薬物動態パラメータをもとに 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、0～24 時間までの血漿中濃度曲線下面積 AUC₀₋₂₄ は log(0.921)～log(1.054)、C_{max} は log(0.903)～log(1.093)であり、後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインが要求する log(0.80)～log(1.25)の範囲内であった。

	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)
フェキソフェナジン塩酸塩錠 OD60mg「FFP」	1232±390	159.5±69.1	2.5±1.0	5.4±0.5
標準製剤 (口腔内崩壊錠、60mg)	1255±426	158.9±67.1	2.8±1.5	5.5±0.7

(Mean±S.D., n=30)

VII. 薬物動態に関する項目



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」を参照

(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)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

「VII.薬物動態に関する項目 1.(3)臨床試験で確認された血中濃度」を参照

(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

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

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)乳汁への移行性

「Ⅷ.安全性（使用上の注意等）に関する項目 10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与」を参照

(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

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(3) 直接血液灌流

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（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.治療に関する項目」を参照すること。

<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。「VIII-14. 適用上の注意」の項参照

5. 慎重投与内容とその理由

該当しない。

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (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。

7. 相互作用

(1)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

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

(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

	頻度不明
精神神経系	頭痛、眠気、疲労、けん怠感、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)}	そう痒、蕁麻疹、潮紅、発疹、血管浮腫
肝臓 ^{注2)}	AST(GOT) 上昇、ALT(GPT) 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

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

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

1)重大な副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、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。

ショック、アナフィラキシー（頻度不明）

2)その他の副作用

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。

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日前から本剤の投与を中止すること。

13. 過量投与

フェキソフェナジン製剤において、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（1800mg～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。

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。)

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(2) 服用時（OD錠のみ）：OD錠60mgは舌の上へのせ唾液を浸潤させ舌で軽くつぶし、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。ただし、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

設定されていない

16. その他

該当資料なし

IX. 非臨床試験に関する項目

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

「VIII.安全性（使用上の注意等）に関する項 10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与(1)」を参照

(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

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（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

錠：気密容器、室温保存
OD錠：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)薬局での取り扱いについて
該当資料なし

(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」を参照

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 「FFP」	PTP包装: 100錠 (10錠×10)
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」	PTP包装: 100錠 (10錠×10)
	140錠 (14錠×10)
	500錠 (10錠×50)
フェキソフェナジン塩酸塩 OD錠 60mg 「FFP」	PTP包装: 100錠 (10錠×10)
	500錠 (10錠×50)

7. 容器の材質

【PTP包装】

PTP包装：ポリ塩化ビニル
化粧箱：紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アレグラ錠 30mg、アレグラ錠 60mg、アレグラ OD錠 60mg

同 効 薬：ケトチフェンフマル酸塩、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、メキタジン、エメダスチン
フマル酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、ベ

X. 管理的事項に関する項目

ポタスチンベンシル酸塩、ロラタジン レボセチリジン塩酸塩 等

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

承認年月日：2013年2月15日

承認番号：

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「FFP」：22500AMX00055000

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「FFP」：22500AMX00054000

フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」：22500AMX00283000

11. 薬価基準収載年月日

2013年6月21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. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は、厚生労働省告示第97号(平成20年3月19日付)で定められた「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT 番号(9桁)	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 「FFP」	122475702	4490023F2063	622247501
フェキソフェナジン塩 酸塩錠 60mg 「FFP」	122476402	4490023F1067	622247601
フェキソフェナジン塩 酸塩 OD 錠 60mg 「FFP」	122477102	4490023F3035	622247701

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) 安定性試験（共創未来ファーマ株式会社 社内資料）
- 2) 溶出試験（共創未来ファーマ株式会社 社内資料）
- 3) 生物学的同等性試験（共創未来ファーマ株式会社 社内資料）

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
該当資料なし

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

なし