

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

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

剤形	錠 30mg・60mg : 錠剤(フィルムコーティング錠) DS6% : シロップ用剤(ドライシロップ)		
製剤の規制区分	該当しない		
規格・含量	錠 30mg : 1錠中 フェキソフェナジン塩酸塩 30mg 錠 60mg : 1錠中 フェキソフェナジン塩酸塩 60mg DS 6% : 1g中 フェキソフェナジン塩酸塩 60mg		
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 発売年月日		錠 30mg・60mg	DS6%
	製造販売承認年月日	2013年8月15日	2014年2月14日
	薬価基準収載年月日	2013年12月13日	2014年6月20日
	発売年月日	2013年12月13日	2014年9月16日
開発・製造販売(輸入) ・提携・販売会社名	製造販売元:高田製薬株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	高田製薬株式会社 学術部 TEL: 0120-989-813 FAX: 048-816-4183 医療関係者向けホームページ https://www.takata-seiyaku.co.jp		

本IFは2017年1月改訂(第4版)の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

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 の利用にあたっては、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	VII. 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	2	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	5	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	12	1. 規制区分	32
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	12	2. 有効期間又は使用期限	32
7. 溶出性	13	3. 貯法・保存条件	32
8. 生物学的試験法	18	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	18	5. 承認条件等	32
10. 製剤中の有効成分の定量法	19	6. 包装	32
11. 力価	19	7. 容器の材質	32
12. 混入する可能性のある夾雑物	19	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	19	9. 国際誕生年月日	33
14. その他	19	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	20	11. 薬価基準収載年月日	33
1. 効能又は効果	20	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
2. 用法及び用量	20	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	33
3. 臨床成績	20	14. 再審査期間	33
VI. 薬効薬理に関する項目	22	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	33
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	22	16. 各種コード	34
2. 薬理作用	22	17. 保険給付上の注意	34
VII. 薬物動態に関する項目	23	XI. 文献	35
1. 血中濃度の推移・測定法	23	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は、ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用だけでなく、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遊離抑制作用を示す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錠 30mg「タカタ」及びフェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」は、高田製薬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)で求められている規格及び試験方法を設定し、加速試験、生物学的同等性試験に関する資料を添付して、2013 年 8 月に製造販売承認を取得、同年 12 月より発売した。

2014 年 2 月、フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」の剤形追加が承認され、同年 9 月より発売した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) フェキソフェナジン塩酸塩は、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。
- (2) 第二世代の抗ヒスタミン剤である。
- (3) 医療過誤防止のため、錠剤に含量を刻印し、PTP シート及び分包には「アレルギー性疾患治療剤」の文言、製品名、含量を見やすく表示した。
- (4) 利便性向上のため、バラ包装のプラスチック瓶には、副片付き分割ラベルを採用した。(DS6%)
- (5) バナナ風味である。(DS6%)
- (6) 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、好中球減少があらわれることがある。(「Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用と初期症状」参照)

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「タカタ」

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」

フェキソフェナジン塩酸塩DS6%「タカタ」

(2) 洋名

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE Tablets 30mg “TAKATA”

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE Tablets 60mg “TAKATA”

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE DS 6% “TAKATA”

(3) 名称の由来

一般名による

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

フェキソフェナジン塩酸塩 (JAN)

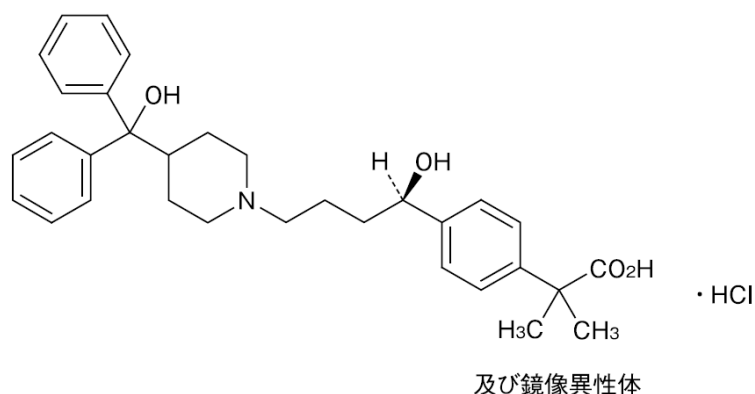
(2) 洋名（命名法）

Fexofenadine Hydrochloride (JAN)

(3) ステム

不明

3. 構造式又は示性式



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

特になし

7. CAS 登録番号

153439-40-8 (Fexofenadine Hydrochloride)

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

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。

結晶多形が認められる。

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」の確認試験法による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

(3) 塩化物の定性反応(2)

4. 有効成分の定量法

日局「フェキソフェナジン塩酸塩」の定量法による。

・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




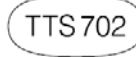
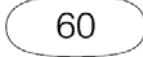
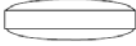
1) 区別

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「タカタ」:錠剤(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「タカタ」:錠剤(フィルムコーティング錠)

フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」:シロップ用剤(ドライシロップ)

2) 外観及び性状

品名	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」		
性状	うすいだ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		
外形	表面 直径	裏面 重さ	側面 厚さ	表面 直径	裏面 重さ	側面 厚さ
	 約 6.6mm	 約 0.105g	 約 3.4mm	 長径:約 12.2mm 短径:約 5.6mm	 約 0.208g	 約 4.1mm

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。

(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「タカタ」:TTS-701

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」:TTS-702

(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

品名	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」
成分・分量	1 錠中 フェキソフェナジン塩酸塩 30mg	1 錠中 フェキソフェナジン塩酸塩 60mg

品名	フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」
成分・分量	1 g 中 フェキソフェナジン塩酸塩 60mg

(2) 添加物

品名	フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg・60mg「タカタ」	フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」
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	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、アスパルテーム(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

(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

(1) 長期保存試験 (25°C±2°C、60%RH±5%RH) ¹⁾

●フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」

最終包装製品を用いた加速試験(40°C、75%RH、6ヵ月)及び長期保存試験(25°C、60%RH、24ヵ月)の結果、3年間安定であることが推測された。

① ポリエチレン瓶入り

(3 ロットのまとめ)

	開始時	6ヵ月後	12ヵ月後	24ヵ月後
性状	微黄白色の粉末を含む微粒で、味は甘かった。			
確認試験	適合			
pH	3.65-3.67	3.63-3.73	3.57-3.59	3.68-3.69
純度試験 類縁物質(%)	0.10	0.12-0.13	0.12-0.13	0.10-0.11
溶出率(%)	87.7-95.5	86.9-94.0	83.2-93.5	84.3-93.0
定量(%)	99.26-99.65	99.77-100.62	99.19-99.93	98.13-98.23
残存率(%)	100	100.1-101.4	99.5-100.7	98.6-98.9
水分(%)	0.36-0.40	0.38-0.40	0.36-0.37	0.34-0.38
分散性(回)	3-4	2-3	2	3
再分散性(回)	4-8	4-16	5-9	4-8

② 1g 分包 (3 ロットのまとめ)

	開始時	6 ヶ月後	12 ヶ月後	24 ヶ月後
性状	微黄白色の粉末を含む微粒で、味は甘かった。			
確認試験	適合			
pH	3.65-3.67	3.67-3.71	3.57-3.60	3.63-3.64
純度試験 類縁物質(%)	0.10	0.14	0.14	0.09-0.10
溶出率(%)	87.7-95.5	87.0-94.1	84.5-94.1	85.7-93.3
定量(%)	99.26-99.65	100.53-100.83	99.97-100.07	98.47-99.45
残存率(%)	100	101.2-101.5	100.3-100.8	99.2-100.2
水分(%)	0.36-0.40	0.39	0.37-0.40	0.34-0.38
分散性(回)	3-4	2	2	3
再分散性(回)	4-8	2-3	4-8	5-9

③ 0.5g 分包 (3 ロットのまとめ)

	開始時	6 ヶ月後	12 ヶ月後	24 ヶ月後
性状	微黄白色の粉末を含む微粒で、味は甘かった。			
確認試験	適合			
pH	3.65-3.67	3.62-3.63	3.63-3.64	3.64-3.66
純度試験 類縁物質(%)	0.10	0.13-0.14	0.13-0.14	0.10-0.12
溶出率(%)	87.7-95.5	86.7-94.3	84.3-93.6	85.6-93.5
定量(%)	99.26-99.65	100.48-101.37	99.90-100.78	98.34-99.66
残存率(%)	100	100.8-102.1	100.3-101.5	99.1-100.4
水分(%)	0.36-0.40	0.35-0.41	0.39-0.43	0.35-0.37
分散性(回)	3-4	2-3	2-3	3
再分散性(回)	4-8	4-16	4-6	6-8

(2) 加速試験 (40°C±1°C、75%RH±5%RH) ^{1~3)}

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「タカタ」

最終包装製品を用いた加速試験(40°C、75%RH、6 ヶ月)の結果、3 年間安定であることが推測された。

PTP 包装(100 錠/袋) (3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
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。			
確認試験	適合			
製剤均一性	1.58-3.79	-	-	1.49-2.98
溶出率(%)	95.0-102.0	90.1-99.5	93.7-98.5	92.1-96.3
定量(%)	99.53-100.20	98.98-99.44	99.66-99.90	99.56-100.51
残存率(%)	100	98.9-99.4	99.5-100.2	99.4-100.5
純度試験 類縁物質(%)	0.04-0.05	0.04-0.06	0.05-0.07	0.07
水分(%)	4.45-4.56	6.42-6.50	6.95-7.39	7.46-7.74

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6 ヶ月)の結果、3 年間安定であることが推測された。

PTP 包装(100 錠/袋)

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
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。			
確認試験	適合			
製剤均一性	2.33-4.27	-	-	1.32-3.26
溶出率(%)	88.5-94.9	90.8-99.9	88.8-96.6	89.4-100.0
定量(%)	99.41-100.08	99.05-100.34	99.96-100.65	99.76-101.08
残存率(%)	100	99.6-100.8	100.4-101.0	100.4-101.6
純度試験 類縁物質(%)	0.02-0.04	0.04-0.05	0.05-0.08	0.06-0.08
水分(%)	4.49-5.09	5.95-6.09	6.92-7.24	7.82-7.92

●フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」

①ポリエチレン瓶入り

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状	微黄白色の粉末を含む微粒で、味は甘かった。			
確認試験	適合			
pH	3.65-3.67	3.63-3.65	3.70-3.71	3.68-3.74
純度試験 類縁物質(%)	0.10	0.10	0.14-0.15	0.16-0.17
製剤均一性	適合	-	-	適合
溶出率(%)	87.7-95.5	82.8-94.6	80.8-95.6	87.7-93.6
定量(%)	99.26-99.65	100.61-101.36	99.71-99.96	98.82-99.34
残存率(%)	100	101.4-101.7	100.2-100.7	99.6-100.1
水分(%)	0.36-0.40	0.31-0.32	0.30-0.35	0.38-0.41
分散性(回)	3-4	3-4	2-3	3
再分散性(回)	4-8	4-5	3	6-11

②1g 分包

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状	微黄白色の粉末を含む微粒で、味は甘かった。			
確認試験	適合			
pH	3.65-3.67	3.65-3.67	3.64-3.67	3.69-3.73
純度試験 類縁物質(%)	0.10	0.10-0.11	0.16-0.17	0.19-0.21
製剤均一性	適合	-	-	適合
溶出率(%)	87.7-95.5	86.2-95.3	85.2-94.7	86.5-94.2
定量(%)	99.26-99.65	99.66-100.41	100.19-100.54	99.57-100.34
残存率(%)	100	100.4-101.2	100.7-101.3	100.3-100.9
水分(%)	0.36-0.40	0.31	0.31-0.33	0.37-0.38
分散性(回)	3-4	3	3	1-2
再分散性(回)	4-8	3-5	3-4	3-8

③0.5g 分包

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状	微黄白色の粉末を含む微粒で、味は甘かった。			
確認試験	適合			
pH	3.65-3.67	3.64-3.67	3.62-3.69	3.63-3.66
純度試験 類縁物質(%)	0.10	0.10-0.11	0.15-0.16	0.18-0.19
製剤均一性	適合	-	-	適合
溶出率(%)	87.7-95.5	80.9-94.1	86.7-94.3	87.9-94.9
定量(%)	99.26-99.65	100.81-101.47	99.53-100.16	100.06-100.17
残存率(%)	100	101.6-102.0	99.9-100.9	100.5-100.9
水分(%)	0.36-0.40	0.30-0.31	0.31-0.36	0.34-0.36
分散性(回)	3-4	3	2	3
再分散性(回)	4-8	3-6	3-6	3-6

(2) 無包装状態での安定性 (参考資料) ^{1~3)}

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「タカタ」

①温度:40°C±2°C(遮光、気密容器)

	開始時	1 ヶ月後	2 ヶ月後	3 ヶ月後
性状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠			
溶出性(%)	92.4-99.2	89.9-94.0	90.3-97.1	92.5-95.3
定量(%)	98.87	101.80	99.94	102.08
残存率(%)	—	103.0	101.1	103.2
硬度(N)*	111.6	108.3	113.0	109.1

*硬度は自主設定項目、n=10 の平均値

②湿度:25°C±2°C、75%RH±5%RH(遮光、開放)

	開始時	1 ヶ月後	2 ヶ月後	3 ヶ月後
性状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠			
溶出性(%)	92.4-99.2	91.6-96.2	87.8-97.1	90.3-94.4
定量(%)	98.87	100.70	100.88	99.46
残存率(%)	—	101.9	102.0	100.6
硬度(N)*	111.6	83.3	82.7	81.9

*硬度は自主設定項目、n=10 の平均値

③光:昼光色蛍光ランプ 1000lx(気密容器、室温)

	開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠		
溶出性(%)	92.4-99.2	87.5-95.6	88.8-93.1
定量(%)	98.87	101.33	100.16
残存率(%)	—	102.5	101.3
硬度(N)*	111.6	95.0	92.3

*硬度は自主設定項目、n=10 の平均値

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」

①温度:40°C±2°C(遮光、気密容器)

	開始時	1ヵ月後	2ヵ月後	3ヵ月後
性状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠			
溶出性(%)	87.7-92.1	87.6-90.1	84.9-93.3	83.9-93.9
定量(%)	98.69	100.63	100.31	98.46
残存率(%)	—	102.0	101.6	99.8
硬度(N) [*]	188.9	188.1	191.7	192.2

※硬度は自主設定項目、n=10の平均値

②湿度:25°C±2°C、75%RH±5%RH(遮光、開放)

	開始時	1ヵ月後	2ヵ月後	3ヵ月後
性状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠			
溶出性(%)	87.7-92.1	79.9-91.9	84.8-91.4	85.7-91.5
定量(%)	98.69	100.12	99.70	100.03
残存率(%)	—	101.4	101.0	101.4
硬度(N) [*]	188.9	144.3	138.0	138.3

※硬度は自主設定項目、n=10の平均値

③光:昼光色蛍光ランプ 1000lx(気密容器、室温)

	開始時	60万lx・hr	120万lx・hr
性状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠		
溶出性(%)	87.7-92.1	81.6-92.9	84.9-91.6
定量(%)	98.69	99.88	99.63
残存率(%)	—	101.2	101.0
硬度(N) [*]	188.9	173.1	166.4

※硬度は自主設定項目、n=10の平均値

●フェキソフェナジン塩酸塩 DS6「タカタ」

湿度:25°C±2°C、75%RH±5%RH(遮光、開放)

	開始時	1ヵ月後	2ヵ月後	3ヵ月後
性状	微黄白色の微粒			
純度試験 類縁物質(%)	0.23	0.25	0.27	0.30
溶出性(%)	78.3	78.2	79.8	80.3
定量(%)	102.1	101.9	101.3	100.9
残存率(%)	-	99.8	99.2	98.8

(3) 苛酷試験¹⁾

●フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」

①温度:60℃±1℃、3ヵ月後

	開始時	ポリエチレン瓶 入り	1g 分包	0.5g 分包	無包装
性状	微黄白色の粉末を含む微粒で、味は甘かった。				
確認試験	適合				
pH	3.65	3.68	3.62	3.60	3.71
純度試験 類縁物質(%)	0.10	0.44	0.54	0.52	1.56
溶出率(%)	87.7-89.8	85.8-86.6	86.5-87.4	87.7-88.4	85.2-86.2
定量(%)	99.26	99.01	99.23	99.78	97.37
残存率(%)	100	99.7	100.0	100.5	98.1
水分(%)	0.36	0.22	0.24	0.23	0.38
分散性(回)	4	4	3	4	4
再分散性(回)	6	3	4	3	4

②湿度:25℃、90%RH、4週間後

	開始時	ポリエチレン瓶 入り	1g 分包	0.5g 分包	無包装
性状	微黄白色の粉末を含む微粒で、味は甘かった。				
確認試験	適合				
pH	3.77	3.87	3.83	3.77	3.85
純度試験 類縁物質(%)	0.14	0.17	0.20	0.20	0.20
溶出率(%)	90.5-92.0	89.5-91.0	86.3-88.2	79.4-81.3	79.4-81.2
定量(%)	99.23	99.24	98.15	98.23	96.65
残存率(%)	100	100.0	99.0	99.0	97.4
水分(%)	0.31	0.31	2.19	2.31	4.52
分散性(回)	2	2	2	2	4
再分散性(回)	4	4	7	3	3

③光:照度 3000lx/hr、120 万 lx・hr 照射後

	開始時	ポリエチレン瓶 入り	1g 分包	0.5g 分包	無包装
性状	微黄白色の粉末を含む微粒で、味は甘かった。				
確認試験	適合				
pH	3.65	3.72	3.72	3.73	3.76
純度試験 類縁物質(%)	0.10	0.11	0.10	0.10	0.16
溶出率(%)	87.7-89.8	80.0-82.8	83.9-86.0	83.3-84.9	85.5-87.0
定量(%)	99.26	99.27	99.40	99.24	99.04
残存率(%)	100	100.0	100.1	100.0	99.8
水分(%)	0.36	0.34	0.59	0.57	0.54
分散性(回)	4	3	3	3	3
再分散性(回)	6	9	9	12	12

5. 調製法及び溶解後の安定性

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。

6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

別資料参照

7. 溶出性

(1) 公的溶出試験の適合性^{4~5)}

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg・60mg「タカタ」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。

溶出規格

試験液	回転数	方法	規定時間	溶出率
水 900mL	毎分 50 回転	パドル法	30 分	80%以上

(2) 生物学的同等性試験ガイドラインにおける標準製剤との溶出挙動の評価^{6~7)}

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「タカタ」

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。

溶出試験法:パドル法

試験液:水、pH1.2、pH4.0、pH6.8

回転数:毎分 50 及び 100 回転 (pH4.0 のみ)

試験回数:12 ベッセル

分析法:液体クロマトグラフィー

溶出挙動の同等性の判定基準:

回転数	試験液	判定
50	水	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。
	pH1.2 溶出試験第 1 液	標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点 (5 分及び 30 分)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。
	pH4.0 薄めた McIlvaine の 緩衝液	標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点 (5 分及び 60 分)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。
	pH6.8 溶出試験第 2 液	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。
100	pH4.0 薄めた McIlvaine の 緩衝液	標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点 (5 分及び 60 分)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。

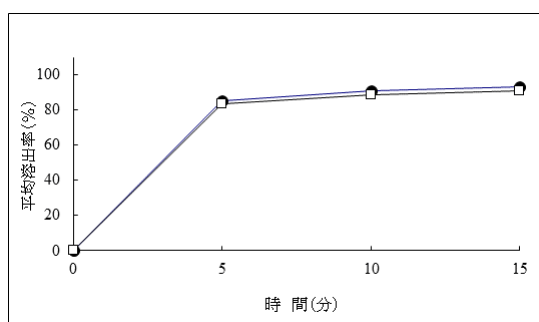
判定結果:

1)平均溶出率

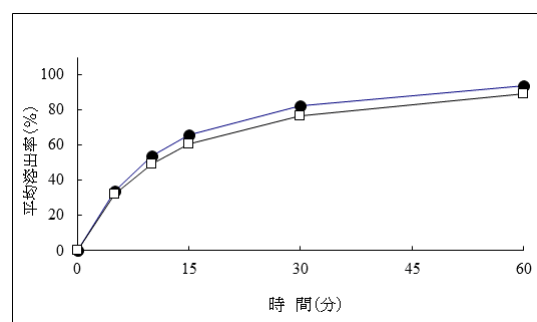
試験条件		判定基準		平均溶出率(%)			判定結果
回転数 (rpm)	試験液	平均溶出率	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤	差	
50	水	85%以上	15	93.2	90.9	-	適合
	pH1.2	±10%	5	33.8	32.0	-1.8	適合
		±10%	30	82.5	76.9	-5.6	適合
	pH4.0	±10%	5	38.7	38.7	0	適合
		±10%	60	86.9	88.5	+1.6	適合
pH6.8	85%以上	15	99.3	96.3	-	適合	
100	pH4.0	±10%	5	44.5	49.2	+4.7	適合
		±10%	60	89.4	90.8	+1.4	適合

2)個々の溶出率

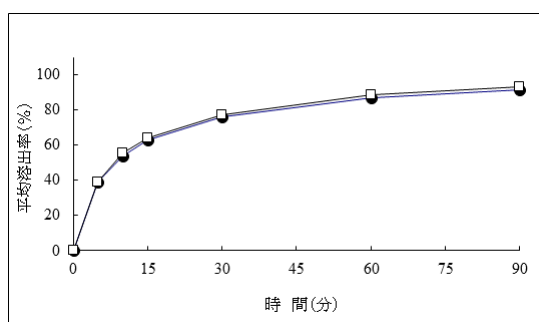
試験条件		最終判定時間 (分)	平均溶出率 (%)	最終判定時間の試験製剤の個々の溶出率(%)		平均溶出率±15% の範囲の個数	判定結果
回転数 (rpm)	試験液			最大値	最小値		
50	水	15	90.9	93.9	86.5	12	適合
	pH1.2	30	76.9	80.8	69.7	12	適合
	pH4.0	60	88.5	93.3	85.9	12	適合
	pH6.8	15	96.3	99.5	91.6	12	適合
100	pH4.0	60	90.8	91.8	88.9	12	適合



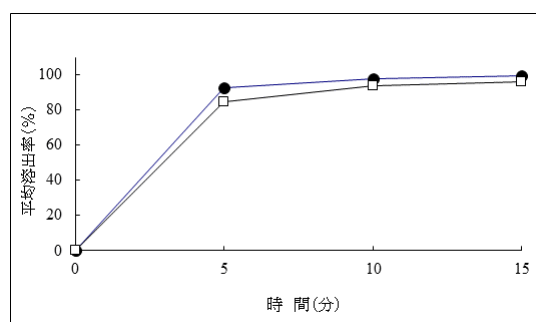
水, 50rpm



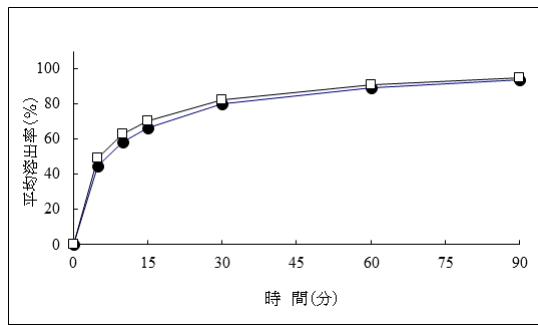
pH1.2, 50rpm



pH4.0, 50rpm



pH6.8, 50rpm



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」

pH4.0, 100rpm

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審第487号)」及び「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正(平成13年5月31日付医薬審発第786号)(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「タカタ」と標準製剤との溶出挙動の類似性を評価した。

溶出試験法:パドル法

試験液:水、pH1.2、pH4.0、pH6.8

回転数:毎分50及び100回転(pH4.0のみ)

試験回数:12ベッセル

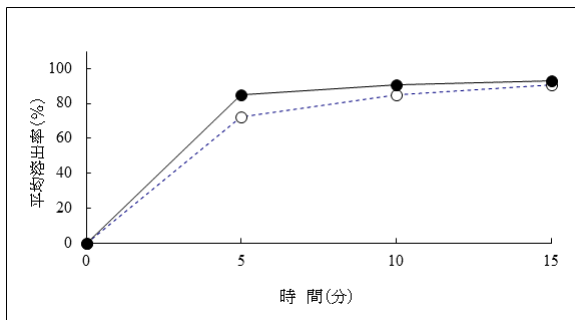
分析法:液体クロマトグラフィー

溶出挙動の類似性の判定基準:

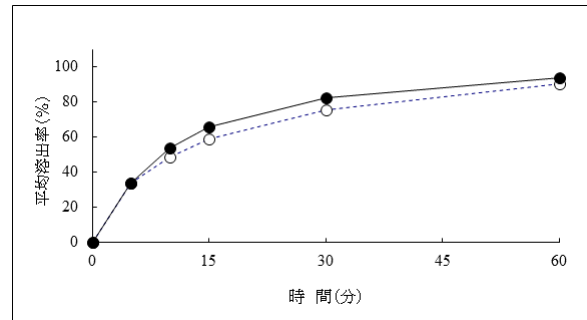
回転数	試験液	判定
50	水	試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH1.2 溶出試験第1液	標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点(5分及び60分)において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH4.0 薄めたMcIlvaineの緩衝液	標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点(5分及び60分)において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH6.8 溶出試験第2液	試験製剤が15分以内に平均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±15%の範囲にある。
100	pH4.0 薄めたMcIlvaineの緩衝液	標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点(5分及び60分)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。

判定結果:

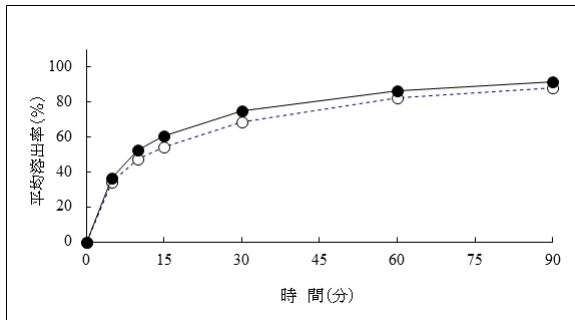
試験条件		判定基準		平均溶出率(%)			判定結果
回転数 (rpm)	試験液	平均溶出率	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤	差	
50	水	85%以上	15	90.5	93.2	+2.7	適合
	pH1.2	±15%	5	33.6	33.8	+0.2	適合
		±15%	60	90.4	93.9	+3.5	適合
	pH4.0	±15%	5	34.1	36.4	+2.3	適合
		±15%	60	82.1	86.5	+4.4	適合
	pH6.8	85%以上	15	96.1	99.3	+3.2	適合
100	pH4.0	±15%	5	41.1	44.5	+3.4	適合
		±15%	60	86.3	89.4	+3.1	適合



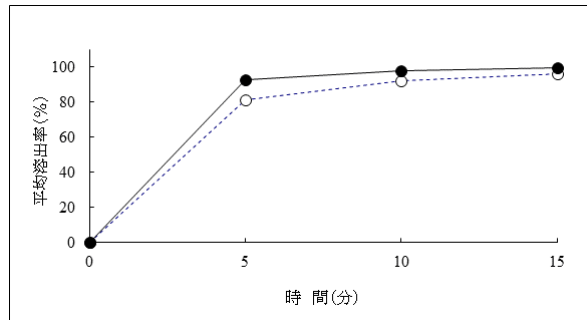
水, 50rpm



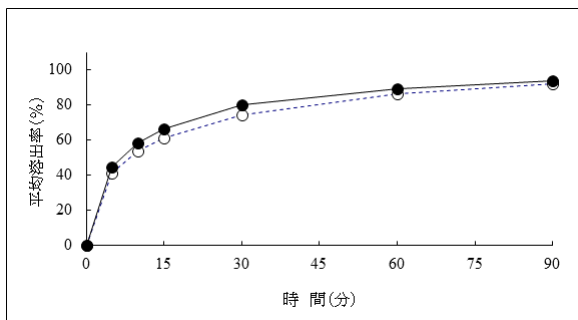
pH1.2, 50rpm



pH4.0, 50rpm



pH6.8, 50rpm



pH4.0, 100rpm

●— フェキソフェナジン 塩酸塩錠 60mg「タカタ」
 ○--- 標準製剤(錠剤、60mg)

●フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審第487号)」及び「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正(平成13年5月31日付医薬審発第786号)(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 DS6%「タカタ」と標準製剤との溶出挙動の類似性を評価した。

溶出試験法:パドル法

試験液:水、pH1.2、pH4.0、pH6.8

回転数:毎分50及び100回転(pH4.0のみ)

試験回数:12ベッセル

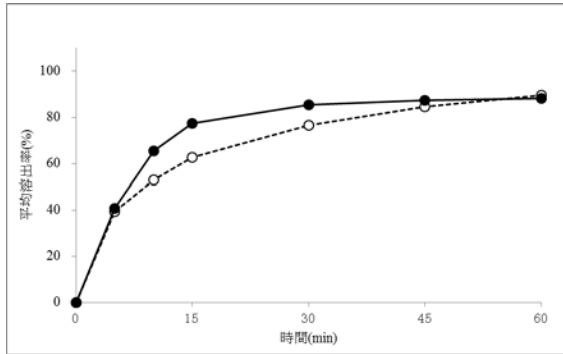
分析法:液体クロマトグラフィー

溶出挙動の類似性の判定基準:

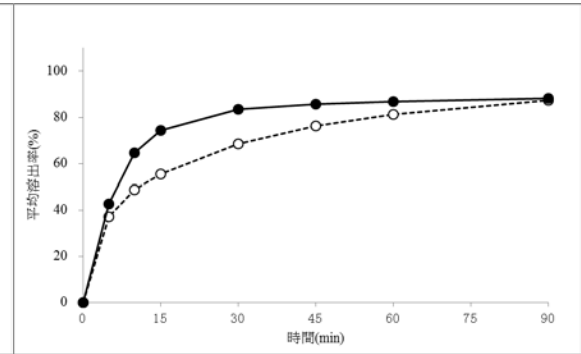
回転数	試験液	判定
50	水	試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH1.2 溶出試験第1液	標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点(5分及び45分)において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH4.0 薄めたMcIlvaineの緩衝液	標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点(5分及び90分)において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH6.8 溶出試験第2液	試験製剤が15分以内に平均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±15%の範囲にある。
100	pH4.0 薄めたMcIlvaineの緩衝液	標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点(5分及び60分)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。

判定結果:

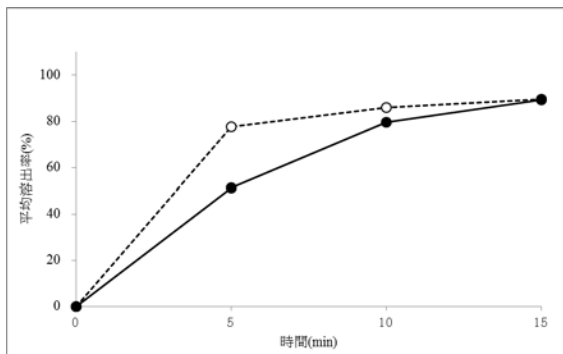
試験条件		判定基準		平均溶出率(%)			判定結果
回転数(rpm)	試験液	平均溶出率	判定時間(分)	標準製剤	試験製剤	差	
50	水	85%以上	15	87.2	90.1	+2.9	適合
	pH1.2	±15%	5	39.4	40.8	+1.4	適合
		±15%	45	84.6	87.3	+2.7	適合
	pH4.0	±15%	5	37.2	42.8	+5.6	適合
		±15%	90	87.4	88.1	+0.7	適合
pH6.8	85%以上	15	89.7	89.4	-0.3	適合	
100	pH4.0	±15%	5	42.6	46.4	+3.8	適合
		±15%	60	86.0	87.0	+1.0	適合



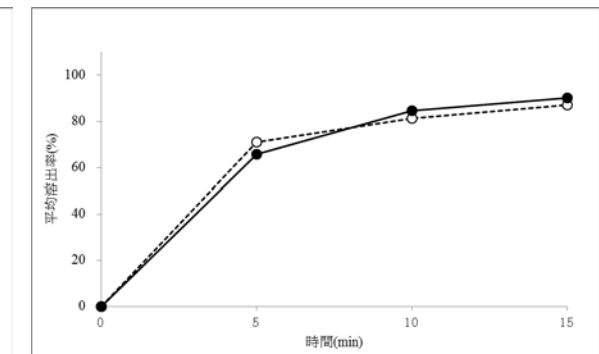
試験液:pH1.2, 回転数:50rpm



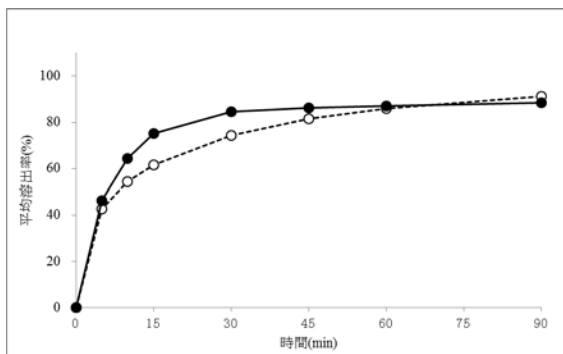
試験液:pH4.0, 回転数:50rpm



試験液:pH6.8, 回転数:50rpm



試験液:水, 回転数:50rpm



試験液:pH4.0, 回転数:100rpm

●— フェキソフェナジン塩酸塩 DS6「タカタ」
 ●--- 標準製剤(錠剤、60mg)

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・60mg「タカタ」
 日局「フェキソフェナジン塩酸塩錠」の確認試験法による。
 ・紫外可視吸光度測定法
- フェキソフェナジン塩酸塩 DS6「タカタ」
 (1) アントロン試液による呈色

(2) ろ液残留物の融点測定(226～230℃)

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・60mg「タカタ」
日局「フェキソフェナジン塩酸塩錠」の定量法による。
 - ・液体クロマトグラフィー

- フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」
 - ・液体クロマトグラフィー

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. 注意が必要な容器・外観が特殊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、皮膚掻痒症、アトピー性皮膚炎)に伴う掻痒

2. 用法及び用量

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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

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

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。

(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^{6~7)}

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」:投与約 2.1 時間後 (n=20)

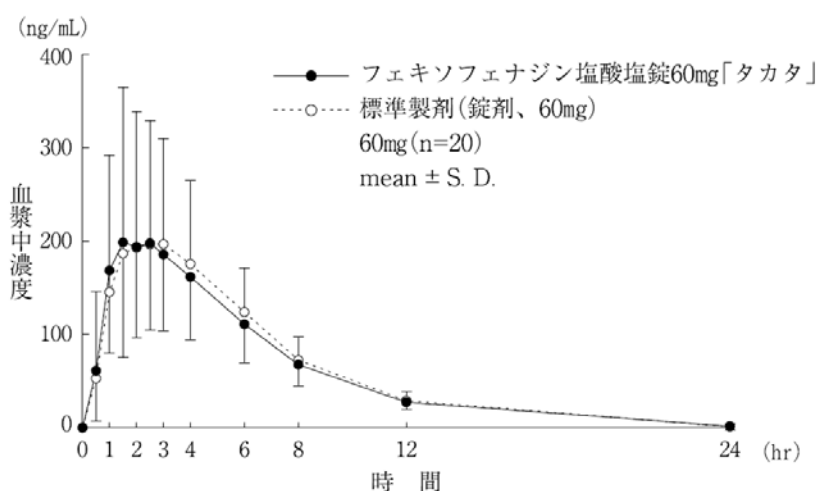
フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」:投与約 1.6 時間後 (n=20)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

〈生物学的同等性試験〉^{6~7)}

●フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」

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。



図VII-1 フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」と標準製剤投与後の
フェキソフェナジンの平均血漿中濃度推移

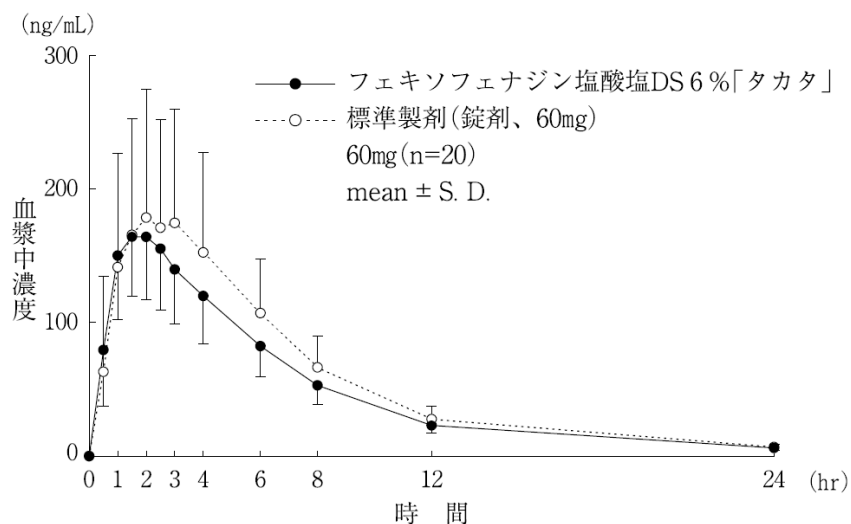
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」	1444.6 ± 501.5	246.5 ± 122.2	2.1 ± 1.2	3.3 ± 0.7
標準製剤(錠剤、60mg)	1501.6 ± 686.5	252.1 ± 169.4	2.6 ± 1.0	3.1 ± 0.6

(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。

●フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」

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。



図VII-2 フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」と標準製剤投与後のフェキソフェナジンの平均血漿中濃度推移

	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 DS6%「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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(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

該当しない

(3) バイオアベイラビリティ

該当しない

(4) 消失速度定数^{6~7)}

	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」(n=20)	フェキソフェナジン塩酸塩 DS 6%「タカタ」(n=20)
$k_{el}(\text{hr}^{-1})$	0.22 ± 0.04	0.1341 ± 0.0181

mean \pm S.D.

(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

3. 吸収

該当しない

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

該当資料なし

(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

該当しない

(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. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

該当記載事項なし

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

該当記載事項なし

(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。
エリスロマイシン	本剤の血漿中濃度を上昇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（頻度不明）と初期症状

- 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

種 類	副 作 用 発 現 頻 度
	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) 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) 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

「Ⅷ. 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）」に以下の記載あり。

【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

「Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用（頻度不明）と初期症状」に以下の記載あり。

- 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。

「Ⅷ. 8. (3) その他の副作用」に以下の記載あり。

過敏症(血管浮腫、痒痒、蕁麻疹、潮紅、発疹)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

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。

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に指導すること。[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。

15. その他の注意

該当記載事項なし

16. その他

該当記載事項なし

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
該当資料なし
- (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:フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「タカタ」:該当しない
フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「タカタ」:該当しない
フェキソフェナジン塩酸塩DS6%「タカタ」:該当しない
有効成分:フェキソフェナジン塩酸塩:該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限:外箱等に表示 (3年) (「IV. 4. 製剤の各種条件下における安定性」参照)

3. 貯法・保存条件

気密容器に入れ、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

(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)

「VIII. 14. 適用上の注意」参照

くすりのしおり:有り

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

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「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DS6%「タカタ」	分包:0.5g×120包、1g×120包 バラ包装:100g(プラスチック瓶)

7. 容器の材質

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg・60mg「タカタ」	PTPシート	ポリ塩化ビニリデン・ポリ塩化ビニル複合フィルム、アルミニウム箔
フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」	分包	ポリエチレン・セロファンラミネートフィルム
	バラ包装	ポリエチレン(瓶)、ポリプロピレン(キャップ)

8. 同一成分・同効薬

同一成分〔先発品〕:アレグラ

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

9. 国際誕生年月日

1996年3月11日(英国での承認日)

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

	製造販売承認年月日	承認番号
フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「タカタ」	2013年8月15日	22500AMX01496
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」	2013年8月15日	22500AMX01497
フェキソフェナジン塩酸塩DS6%「タカタ」	2014年2月14日	22600AMX00408

11. 薬価基準収載年月日

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg・60mg「タカタ」:2013年12月13日

フェキソフェナジン塩酸塩 DS6%「タカタ」:2014年6月20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

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「タカタ」	122752901	4490023F2284	622275201
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「タカタ」	122753601	4490023F1288	622275301
フェキソフェナジン塩酸塩DS6%「タカタ」	123348301	4490023R1039	622334801

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。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 高田製薬㈱社内資料(DS6%:安定性)
- 2) 高田製薬㈱社内資料(錠 30mg:安定性)
- 3) 高田製薬㈱社内資料(錠 60mg:安定性)
- 4) 高田製薬㈱社内資料(錠 30mg:溶出性)
- 5) 高田製薬㈱社内資料(錠 60mg:溶出性)
- 6) 高野和彦他:診療と新薬, 50(9):837,2013
- 7) 高田製薬㈱社内資料(DS6%:生物学的同等性)

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 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

MEMO

MEMO

MEMO

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

FXF-1(4) 2018年12月改訂