

## アレルギー性疾患治療剤

劇薬・処方箋医薬品\*

日本標準商品分類番号

87449

## プソフェキ® 配合錠「サワイ」

## PUSOFEKI® Combination Tablets [SAWAI]

フェキソフェナジン塩酸塩・塩酸プソイドエフェドリン配合錠

貯法：室温保存  
使用期限：外箱に表示

|      |                  |
|------|------------------|
| 承認番号 | 30200AMX00239000 |
| 薬価収載 | 2020年6月          |
| 販売開始 | 2020年9月          |

\*注意—医師等の処方箋により使用すること

## 【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

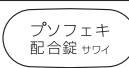
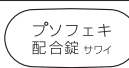
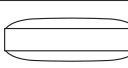
- 1) 本剤の成分及び塩酸プソイドエフェドリンと化学構造が類似する化合物(エフェドリン塩酸塩又はメチルエフェドリン塩酸塩を含有する製剤)に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) 重症の高血圧の患者〔症状が悪化するおそれがある。〕
- 3) 重症の冠動脈疾患の患者〔症状が悪化するおそれがある。〕
- 4) 閉塞隅角緑内障の患者〔症状が悪化するおそれがある。〕
- 5) 尿閉のある患者〔症状が悪化するおそれがある。〕
- 6) 交感神経刺激薬による不眠、めまい、脱力、振戦、不整脈等の既往歴のある患者〔塩酸プソイドエフェドリンの交感神経刺激作用が強くなるおそれがある。〕

## 【組成・性状】

## ・組成

|               |   |
|---------------|---|
| 有効成分<br>[1錠中] | 日局フェキソフェナジン塩酸塩 30mg<br>塩酸プソイドエフェドリン 60mg  |
| 添加剤           | カルナウバロウ、クロスカルメロースNa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、硬化油、酸化チタン、三酸化鉄、ステアリン酸、ステアリン酸Mg、タルク、ヒドロキシプロピルセルロース、部分アルファー化デンプン、ポリビニルアルコール・ポリエチレングリコール・グラフトコポリマー |

## ・製剤の性状

|        |   |
|--------|---|
| 外形     |    |
| 剤形     | フィルムコーティング錠(徐放層を含む多層錠)  |
| 性状     | うすいだいだい色  |
| 直径(mm) | 17.5×7.8  |
| 厚さ(mm) | 5.7   |
| 重量(mg) | 約587  |
| 本体表示   | プソフェキ 配合錠 サワイ   |

## 【効能・効果】

## アレルギー性鼻炎

## 〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

鼻閉症状が中等症以上の場合に本剤の使用を検討すること。

## 【用法・用量】

通常、成人及び12歳以上の小児には1回2錠(フェキソフェナジン塩酸塩として60mg及び塩酸プソイドエフェドリンとして120mg)を1日2回、朝及び夕の空腹時に経口投与する。

## 〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

塩酸プソイドエフェドリンは主として腎臓を経て尿中に排泄されるので、腎機能障害のある患者では適宜減量すること。〔排泄が遅延し、作用が強くなるおそれがある。〔慎重投与〕の項参照〕

## 【使用上の注意】

## 1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 糖尿病の患者〔血糖値が上昇するおそれがある。〕
- 2) 高血圧の患者〔血圧が上昇するおそれがある。〕
- 3) 虚血性心疾患の患者〔虚血性心疾患が悪化するおそれがある。〕
- 4) 眼圧上昇のある患者〔眼圧が上昇するおそれがある。〕
- 5) 甲状腺機能亢進症の患者〔交感神経刺激作用が増強するおそれがある。〕
- 6) 前立腺肥大のある患者〔排尿困難が悪化するおそれがある。〕
- 7) 腎機能障害のある患者〔用法・用量に関連する使用上の注意〕の項参照)

## 2. 重要な基本的注意

- 1) 本剤の使用は鼻閉症状が強い期間のみの最小限の期間にとどめ、鼻閉症状の緩解がみられた場合には、速やかに抗ヒスタミン剤単独療法等への切り替えを考慮すること。〔本剤を2週間を超えて投与したときの有効性及び安全性は臨床試験では検討されていない。2週間を超えて投与する場合には患者の症状を確認しながら投与すること。〕
- 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。

## 3. 相互作用

## 併用注意(併用に注意すること)

| 薬剤名等                                  | 臨床症状・措置方法  | 機序・危険因子  |
|---------------------------------------|--|--|
| 制酸剤(水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウム含有製剤)          | フェキソフェナジン塩酸塩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フェキソフェナジン塩酸塩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                              | フェキソフェナジン塩酸塩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フェキソフェナジン塩酸塩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。               |
| 交感神経系に対し抑制的に作用する降圧剤<br>メチルドパ<br>レセルピン | 降圧作用が減弱することがある。                                    | 塩酸プソイドエフェドリンの交感神経刺激作用により、交感神経抑制作用を減弱する。                              |

| 薬 剤 名 等              | 臨床症状・措置方法                          | 機序・危険因子                                     |
|----------------------|------------------------------------|---|
| 交感神経刺激薬              | 塩酸プソイドエフェドリンの心血管に対する作用が増強されることがある。 | 共に交感神経刺激作用を有するため。                           |
| 選択的MAO-B阻害剤<br>セレギリン | 血圧上昇等が起こるおそれがある。                   | セレギリンのMAO-B選択性が低下した場合、交感神経刺激作用が増強されると考えられる。 |

#### 4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

##### 1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) **ショック、アナフィラキシー**: ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、呼吸困難、血圧低下、意識消失、血管浮腫、胸痛、潮紅等の過敏症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (2) **痙攣**: 痙攣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) **肝機能障害、黄疸**: AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -GTP、Al-P、LDHの上昇等の肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、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。
- (4) **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。
- (5) **急性汎発性発疹性膿疱症**: 急性汎発性発疹性膿疱症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、発熱、紅斑、多数の小膿疱等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  |
|--------------------|---|
| 精神神経系              | しびれ感、眠気、倦怠感、めまい、不眠、神経過敏、悪夢、睡眠障害、中枢神経刺激、激越、落ち着きのなさ、脱力、恐怖、不安、緊張、振戦、幻覚、頭痛、疲労 |
| 消化器                | 便秘、嘔気、嘔吐、腹痛、下痢、消化不良、虚血性大腸炎、口渇   |
| 過敏症 <sup>注1)</sup> | 血管浮腫、そう痒、蕁麻疹、潮紅、発疹  |
| 肝 臓 <sup>注2)</sup> | AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇   |
| 腎臓・泌尿器             | 頻尿、排尿困難、尿閉  |
| 循環器                | 頻脈、動悸、血圧上昇、高血圧、不整脈、循環虚脱   |
| その他                | 味覚異常、浮腫、胸痛、呼吸困難、食欲不振、蒼白、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。

#### 5. 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るので、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。

#### 6. 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。  
〔塩酸プソイドエフェドリンでは、ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。また、フェキソフェナジン塩酸塩では、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。〕

#### 7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は12歳未満の小児に対する有効性及び安全性は確立していない(使用経験がない)。

#### 8. 臨床検査結果に及ぼす影響

フェキソフェナジン塩酸塩は、アレルゲン皮内反応を抑制するため、アレルゲン皮内反応検査を実施する3～5日前から本剤の投与を中止すること。

#### 9. 過量投与

1) フェキソフェナジン塩酸塩の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。フェキソフェナジン塩酸塩の最大耐用量は確立していない。過量投与においては、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、フェキソフェナジン塩酸塩は血液透析によって除去できない。

2) 塩酸プソイドエフェドリンの急性過量投与に関する報告は市販後の情報に限られているが、交感神経刺激薬を大量に投与すると、めまい感、頭痛、悪心、嘔吐、発汗、口渇、頻脈、前胸部痛、動悸、高血圧、排尿困難、筋力低下及び筋緊張、不安、落ち着きのなさ、不眠症などがみられることがある。妄想や幻覚を伴う中毒性精神病がみられる患者も多い。また、不整脈、循環虚脱、痙攣、昏睡、呼吸不全がみられることもある。塩酸プソイドエフェドリンの排泄は、尿pHが低下すると増加する。なお、塩酸プソイドエフェドリンが血液透析によって除去できるかどうかは不明である。

#### 10. 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:

- (1) 本剤は徐放層を含む錠剤であるため、噛んだり、砕いたりせず、水と一緒にそのまま服用すること。
- (2) 糞便中に、有効成分放出後の殻錠が排泄されることがある。

#### 【薬物動態】

##### 生物学的同等性試験

プソフェキ配合錠「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30mg、塩酸プソイドエフェドリンとして60mg)単回経口投与(クロスオーバー法)し、フェキソフェナジン及びプソイドエフェドリンの血漿中濃度を測定した<sup>注)</sup>。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

注) フェキソフェナジンは空腹時投与試験を、徐放層に含まれるプソイドエフェドリンは空腹時及び食後投与試験を行った。

##### 1) フェキソフェナジン

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

|       |               | Cmax<br>(ng/mL) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC <sub>0-24hr</sub><br>(ng·hr/mL) |
|-------|---------------|-----------------|--------------|--------------------------|-------------------------------------|
| 空腹時投与 | プソフェキ配合錠「サワイ」 | 146.5±71.4      | 1.8±0.9      | 5.0±0.8                  | 859.2±307.9                         |
|       | 標準製剤(錠剤、30mg) | 131.4±57.7      | 2.0±1.1      | 4.9±0.9                  | 789.6±259.7                         |

(Mean ± S.D., n=56)

