

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 「NP」
フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg 「NP」

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE TABLETS

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30mg 「NP」
フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg 「NP」

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE OD TABLETS

(フェキソフェナジン塩酸塩口腔内崩壊錠)

貯 法：室温保存
使用期限：容器等に記載
注 意：「取扱い上の注意」参照

	錠30mg	錠60mg	OD錠30mg	OD錠60mg
承認番号	22500AMX00045	22500AMX00046	22500AMX00218	22500AMX00219
薬価収載	2013年6月	2013年6月	2013年6月	2013年6月
販売開始	2013年6月	2013年6月	2013年6月	2013年6月

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

【組成・性状】

1. 組成

販売名	フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg 「NP」	フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg 「NP」	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg 「NP」	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg 「NP」
有効成分（1錠中）	30mg	60mg	30mg	60mg
添加物	結晶セルロース、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 部分アルファー化デンプン、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、酸化チタン、三酸化鉄、黄色三酸化鉄、カルナウバロウ		D-マンニトール、タルク、アンモニオアルキルメタクリレートコポリマー分散液、ククロスボビドン、カルメロース、含水二酸化ケイ素、アスペルテム（L-フェニルアラニン化合物）、アセスルファムカリウム、フマル酸ステアリルナトリウム、l-メントール、香料	

2. 製剤の性状

	フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg 「NP」	フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg 「NP」	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg 「NP」	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg 「NP」
外形				

	フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg 「NP」	フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg 「NP」	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg 「NP」	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg 「NP」
形状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠	白色の素錠（口腔内崩壊錠）	白色の素錠（口腔内崩壊錠）	白色の割線入り素錠（口腔内崩壊錠）
大きさ	直径（mm）	6.6	8.6	7.5
	厚さ（mm）	3.4	4.2	3.1
	重量（mg）	104	206	165
識別コード	NP-175	NP-177	NP-551	NP-552

【効能・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

【用法・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。（「9. 適用上の注意」の項参照）

【使用上の注意】

1. 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。

2. 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	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。

3. 副作用

本剤は、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) 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。

2) その他の副作用

種類\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、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. 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。

5. 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。[動物試験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。]

6. 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）。

7. 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。

8. 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（1,800～3,600mg）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。

9. 適用上の注意

(フェキソフェナジン塩酸塩錠「NP」)

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。]

(フェキソフェナジン塩酸塩OD錠「NP」)

1) 薬剤交付時

(1) 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) 欠けや割れが生じた場合は全量服用すること。

(3) 吸湿性を有するため、服用直前にPTPシートから取り出すこと。

2) 服用時

(1) 本剤は舌の上のにせ唾液を浸潤させ、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。

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

1) フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「NP」

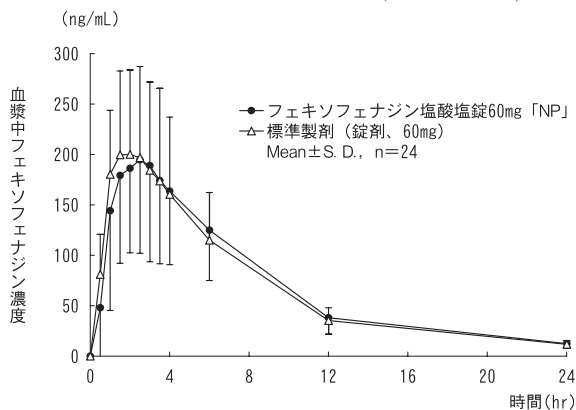
フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「NP」は「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」及び「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)に基づき、フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「NP」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。¹⁾

2) フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「NP」

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「NP」と標準製剤のそれぞれ1錠（フェキソフェナジン塩酸塩として60mg）を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中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_{0-24hr}、C_{max}）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。²⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→24hr} (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「NP」	1681±643	234.43±95.43	2.44±1.35	5.49±0.76
標準製剤 (錠剤、60mg)	1657±618	225.72±93.33	2.13±1.16	5.53±0.75

(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。

3) フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「NP」

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「NP」は「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」及び「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)に基づき、フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「NP」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。³⁾

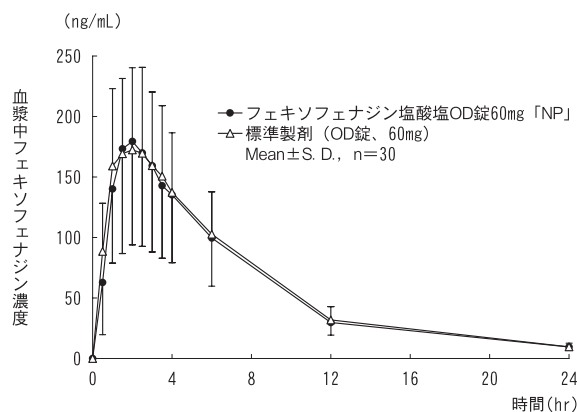
4) フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「NP」

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「NP」と標準製剤のそれぞれ1錠(フェキソフェナジン塩酸塩として60mg)を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中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_{0→24hr}、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。⁴⁾

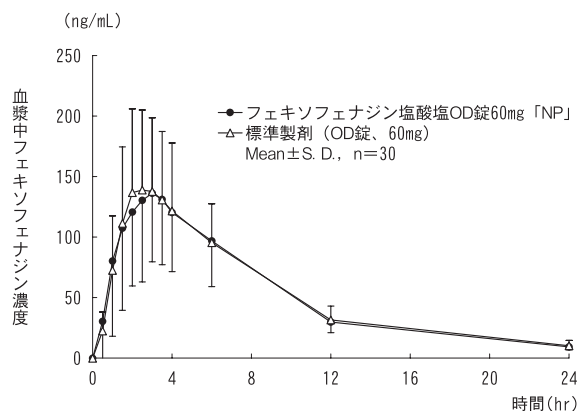
	判定パラメータ		参考パラメータ		
	AUC _{0→24hr} (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)	
水あり投与	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「NP」	1406±510	201.07±90.85	2.07±0.76	5.19±0.54
	標準製剤 (OD錠、60mg)	1462±451	196.03±68.05	1.98±0.80	5.09±0.49
水なし投与	フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「NP」	1232±390	159.48±69.10	2.53±1.02	5.42±0.46
	標準製剤 (OD錠、60mg)	1255±426	158.90±67.08	2.80±1.48	5.50±0.74

(Mean ± S. D., n = 30)

(1) 水あり投与



(2) 水なし投与



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. 溶出挙動

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「NP」及びフェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「NP」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。⁵⁾

【薬効薬理】

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。⁶⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：フェキソフェナジン塩酸塩

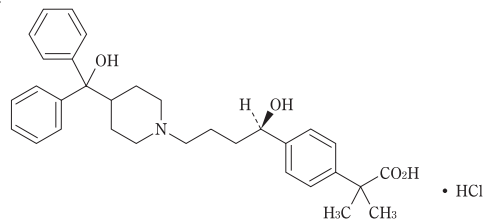
(Fexofenadine Hydrochloride)

化学名：2-(4-{(1R)-1-Hydroxy-4-[4-(hydroxydiphenylmethyl)piperidin-1-yl]butyl}phenyl)-2-methylpropanoic acid monohydrochloride

分子式：C₃₂H₃₉NO₄ · HCl

分子量：538.12

構造式：



及び鏡像異性体

性状：・白色の結晶性の粉末である。

- ・メタノールに極めて溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けやすく、水に溶けにくい。
- ・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。

【取扱い上の注意】

安定性試験

1. フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「NP」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6カ月）の結果、フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「NP」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。⁷⁾

2. フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「NP」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6カ月）の結果、フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「NP」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。⁸⁾

3. フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「NP」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6カ月）の結果、フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「NP」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。⁹⁾

4. フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「NP」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6カ月）の結果、フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「NP」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。¹⁰⁾

※【包装】

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「NP」:

100錠 (PTP)

※フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「NP」:

100錠 (PTP)

140錠 (PTP)

500錠 (PTP、バラ)

フェキソフェナジン塩酸塩OD錠30mg「NP」:

100錠 (PTP)

※フェキソフェナジン塩酸塩OD錠60mg「NP」:

100錠 (PTP)

500錠 (PTP)

※【主要文献】

1)ニプロ (株): 社内資料 (生物学的同等性試験)

2)ニプロ (株): 社内資料 (生物学的同等性試験)

3)ニプロ (株): 社内資料 (生物学的同等性試験)

4)ニプロ (株): 社内資料 (生物学的同等性試験)

5)ニプロ (株): 社内資料 (溶出試験)

※6)第十七改正日本薬局方解説書

7)ニプロ (株): 社内資料 (安定性試験)

8)ニプロ (株): 社内資料 (安定性試験)

9)ニプロ (株): 社内資料 (安定性試験)

10)ニプロ (株): 社内資料 (安定性試験)

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

ニプロ株式会社 医薬品情報室

〒531-8510 大阪市北区本庄西3丁目9番3号

☎ 0120-226-898

FAX 06-6375-0177



製造販売

ニプロ株式会社

大阪市北区本庄西3丁目9番3号