

## 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 2018(2019年更新版)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「三和」**  
**フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「三和」**  
FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE Tablets "SANWA"

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「三和」： 1錠中「日局」フェキソフェナジン塩酸塩 30.0mg フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「三和」： 1錠中「日局」フェキソフェナジン塩酸塩 60.0mg
一般名	和名：フェキソフェナジン塩酸塩（JAN） 洋名：Fexofenadine Hydrochloride（JAN, USP, EP）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	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 販売開始年月日：2013年 6月 21日
製造販売（輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元：日本薬品工業株式会社 販売元：株式会社三和化学研究所
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	株式会社三和化学研究所 コンタクトセンター TEL 0120-19-8130 FAX(052)950-1305 受付時間：9時～17時（土、日、祝日及び弊社休日を除く） 医療関係者向けウェブサイト <a href="https://med.sk-net.com/">https://med.sk-net.com/</a>

本 IF は 2026 年 5 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

## 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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I FはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「I F記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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I Fを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。I Fは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

## 目 次

I. 概要に関する項目	
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的特性	1
3. 製品の製剤学的特性	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1
6. RMPの概要	1
II. 名称に関する項目	
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）又は本質	2
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	2
III. 有効成分に関する項目	
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法，定量法	3
IV. 製剤に関する項目	
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 添付溶解液の組成及び容量	5
4. 力価	5
5. 混入する可能性のある夾雑物	5
6. 製剤の各種条件下における安定性	5
7. 調製法及び溶解後の安定性	5
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5
9. 溶出性	6
10. 容器・包装	9
11. 別途提供される資材類	9
12. その他	10
V. 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	11
2. 効能又は効果に関連する注意	11
3. 用法及び用量	11
4. 用法及び用量に関連する注意	11
5. 臨床成績	11
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	16
2. 薬理作用	16

VII. 薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移	17
2. 薬物速度論的パラメータ	19
3. 母集団（ポピュレーション）解析	20
4. 吸収	20
5. 分布	20
6. 代謝	21
7. 排泄	21
8. トランスポーターに関する情報	21
9. 透析等による除去率	21
10. 特定の背景を有する患者	21
11. その他	22
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	23
2. 禁忌内容とその理由	23
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	23
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	23
5. 重要な基本的注意とその理由	23
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	23
7. 相互作用	24
8. 副作用	24
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	25
10. 過量投与	25
11. 適用上の注意	25
12. その他の注意	26
IX. 非臨床試験に関する項目	
1. 薬理試験	27
2. 毒性試験	27
X. 管理的事項に関する項目	
1. 規制区分	28
2. 有効期間	28
3. 包装状態での貯法	28
4. 取扱い上の注意	28
5. 患者向け資材	28
6. 同一成分・同効薬	28
7. 国際誕生年月日	28
8. 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日	28
9. 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	28
10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	28
11. 再審査期間	29
12. 投薬期間制限に関する情報	29
13. 各種コード	29

14. 保険給付上の注意	29
X I. 文献	
1. 引用文献	30
2. その他の参考文献	32
X II. 参考資料	
1. 主な外国での発売状況	33
2. 海外における臨床支援情報	33
X III. 備考	
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	35
2. その他の関連資料	35

## 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、第二世代抗ヒスタミン薬の一つであり、ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗作用を有し、抗アレルギー薬に分類される<sup>1)</sup>。フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「三和」、フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「三和」は、日本薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、平成 17 年 3 月 31 日付薬食発第 0331015 号厚生労働省医薬食品局長通知「医薬品の承認申請について」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 15 日に承認を取得した。2013 年 6 月 21 日に株式会社三和化学研究所が販売を開始した。

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 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）に伴うそう痒の適応を有している。
- (2) 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<sub>1</sub> 作用に拮抗することにより、アレルギー症状を緩和する<sup>1)</sup>。
- (3) 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. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

### 3. 製品の製剤学的特性

該当しない

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

#### (1) 承認条件

該当しない

#### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

### 6. RMPの概要

該当しない

## 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 「三和」

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」

#### (2) 洋名

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE Tablets 30mg “SANWA”

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE Tablets 60mg “SANWA”

#### (3) 名称の由来

有効成分名に基づき命名

### 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)

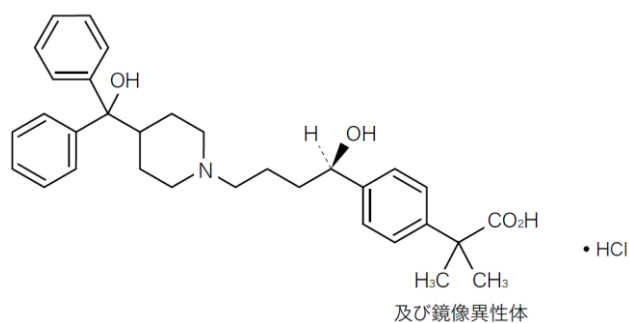
Fexofenadine Hydrochloride (JAN, USP, EP)

Fexofenadine (INN)

#### (3) ステム (stem)

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) 又は本質

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

該当資料なし

### 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。

結晶多形が認められる。

##### (2) 溶解性

溶媒名	本品 1g を溶かすのに要する溶媒量	溶解性
メタノール	1mL 未満	極めて溶解しやすい
エタノール(99.5)	10mL 以上 30mL 未満	やや溶解しやすい
水	100mL 以上 1000mL 未満	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

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法，定量法

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準拠する。

(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

定量法

「日局」フェキソフェナジン塩酸塩の定量法に準拠する。

液体クロマトグラフィー


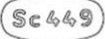



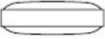
## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「三和」	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「三和」	
性状	うすいだいだい色のフィルムコーティング錠		
外形	表		
	裏		
	側面		
直径	6.6mm	長径：12.1mm 短径：5.6mm	
厚さ	3.3mm	3.9mm	
重量	104mg	206mg	
識別コード	Sc448	Sc449	

#### (3) 識別コード

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」：Sc448

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」：Sc449

#### (4) 製剤の物性

該当資料なし

#### (5) その他

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」
有効成分	1錠中「日局」 フェキソフェナジン塩酸塩 30.0mg	1錠中「日局」 フェキソフェナジン塩酸塩 60.0mg
添加剤	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、 フマル酸ステアリルナトリウム、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、ポビドン、 酸化チタン、マクロゴール 400、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄	

#### (2) 電解質等の濃度

該当しない

#### (3) 熱量

該当しない

### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

### 4. 力価

該当しない

### 5. 混入する可能性のある夾雑物<sup>2,3)</sup>

2-(4-{4-[4-(Hydroxydiphenylmethyl)piperidin-1-yl]butanoyl}-phenyl)-2-methylpropanoic acid

### 6. 製剤の各種条件下における安定性

#### (1) 加速試験<sup>2,3)</sup>

試験項目	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果	
				30mg	60mg
加速試験	40±1℃、 75±5%RH	6 ヶ月	PTP 包装	規格内	規格内
			バラ包装 (ポリエチレン瓶)		規格内

測定項目：性状、確認試験、製剤均一性（含量均一性試験）、溶出性、含量（定量法）、純度試験（類縁物質）、質量試験

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、フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「三和」及びフェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「三和」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。

#### (2) 無包装安定性試験<sup>4,5)</sup>

試験項目	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果	
				30mg	60mg
無包装安定性試験	温度 40℃	3 ヶ月	遮光、気密容器	規格内	規格内
	湿度 25℃、75%RH	3 ヶ月	遮光、開放	1 ヶ月で硬度の低下がみられた（規格内）。その他の項目は規格内。	2 ヶ月で硬度の低下がみられた（規格内）。その他の項目は規格内。
	光 20℃、 1000lx/h	25 日（総照度 60 万 lx・h）	気密容器	規格内	規格内

測定項目：性状、含量、硬度、溶出性

### 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

### 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

## 9. 溶出性

### (1) フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」<sup>6)</sup>

#### ○溶出挙動の同等性

本試験は、平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知「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について」の「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、フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg 「三和」を標準製剤として実施した。

試験方法：「日局」一般試験法溶出試験法（パドル法）

試験液量：900mL

試験液の温度：37±0.5℃

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

試験液：pH1.2＝「日局」溶出試験の第1液

pH4.0＝薄めたMcIlvaineの緩衝液

pH6.8＝「日局」溶出試験の第2液

水

判定基準：以下の(1)及び(2)の基準に適合するとき、溶出挙動が同等であると判定する。

#### (1) 平均溶出率

##### ①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。

##### ②標準製剤が15～30分に平均85%以上溶出する場合

標準製剤の平均溶出率が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%の範囲にあるか、又はf2関数の値が50以上である。

##### ③標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

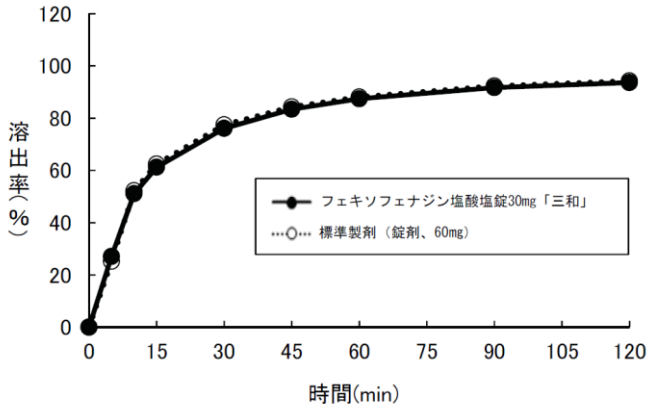
a. 規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあるか、又はf2関数の値は50以上である。

#### (2) 個々の溶出率

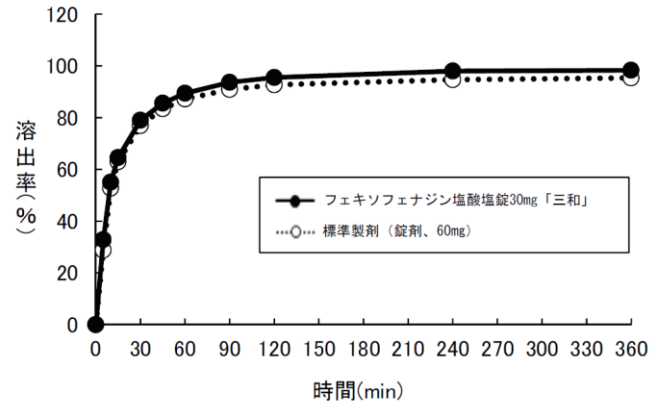
a. 標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

結果：溶出性は判定基準に適合した。

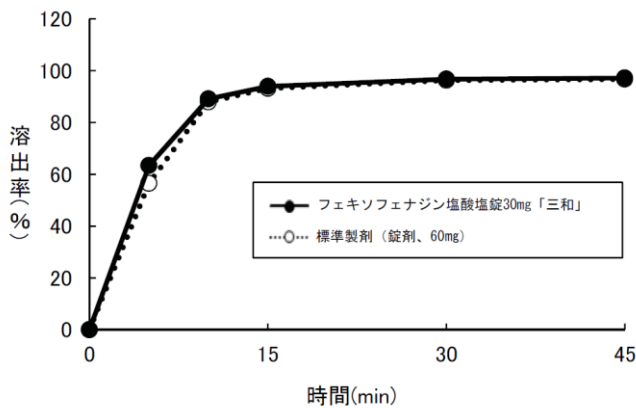
pH1.2、50rpm<判定基準：③a>



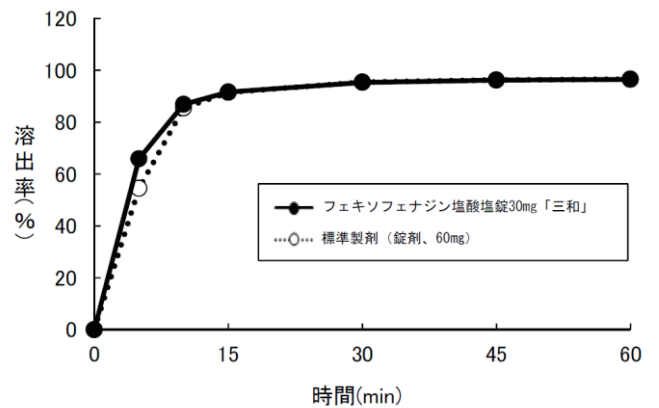
pH4.0、50rpm<判定基準：③a>



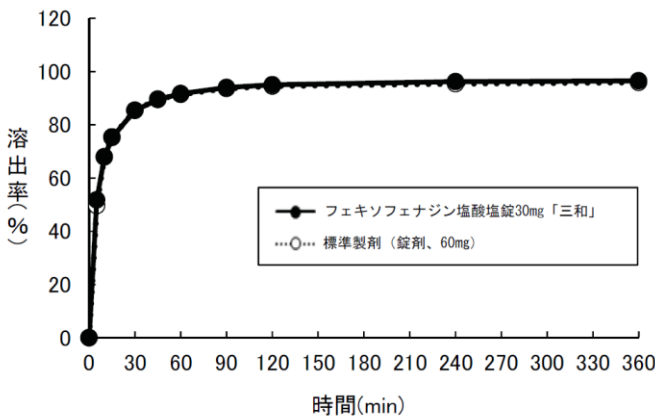
pH6.8、50rpm <判定基準：①>



水、50rpm<判定基準：①>



pH4.0、100rpm<判定基準：②>



○溶出挙動

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「三和」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。

(2)フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「三和」<sup>7)</sup>

○溶出挙動の類似性

本試験は、平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知「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について」に基づき実施した。

試験方法：「日局」一般試験法溶出試験法（パドル法）

試験液量：900mL

試験液の温度：37±0.5℃

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

試験液：pH1.2＝「日局」溶出試験の第1液

pH4.0＝薄めたMcIlvaineの緩衝液

pH6.8＝「日局」溶出試験の第2液

水

判定基準：以下の基準に適合するとき、溶出挙動が類似であると判定する。

①標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合

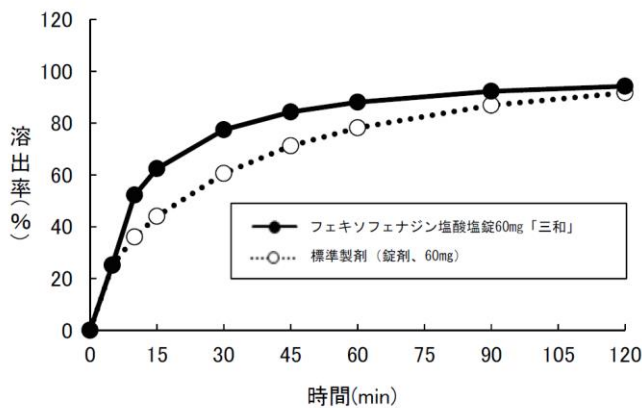
試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

③標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合、以下の基準に適合する。

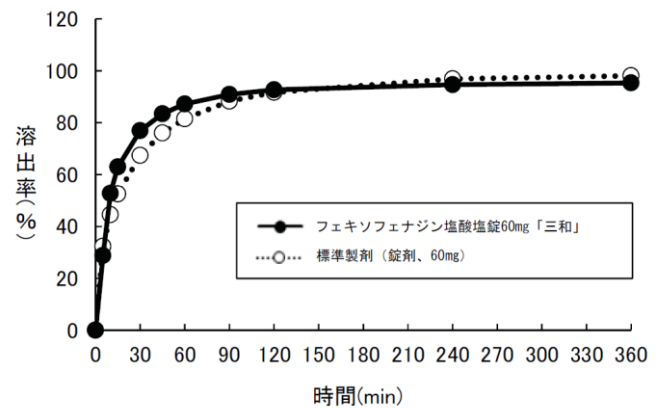
a. 規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値は42以上である。

結果：1 試験条件 (回転数：100rpm、試験液：pH1.2) において判定基準に適合しなかった (f2 関数：37.7) ことから、標準製剤との溶出挙動の類似性は得られなかった。なお、本溶出試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものではない。

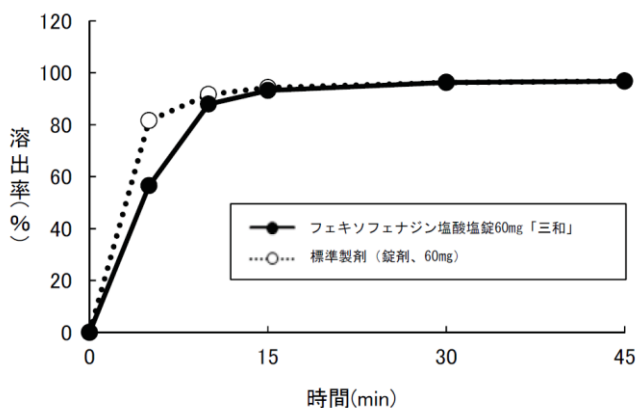
pH1.2、50rpm <判定基準：③a>



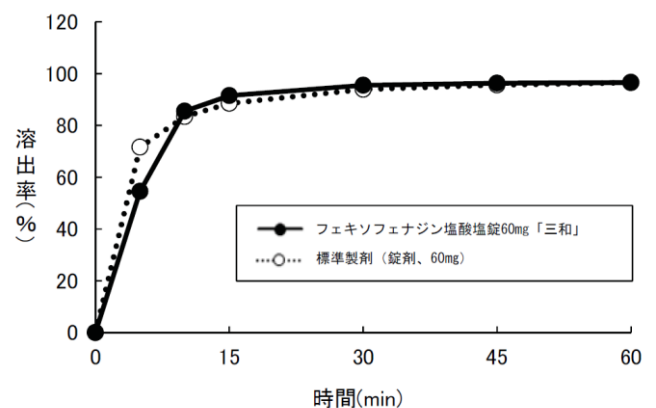
pH4.0、50rpm <判定基準：③a>



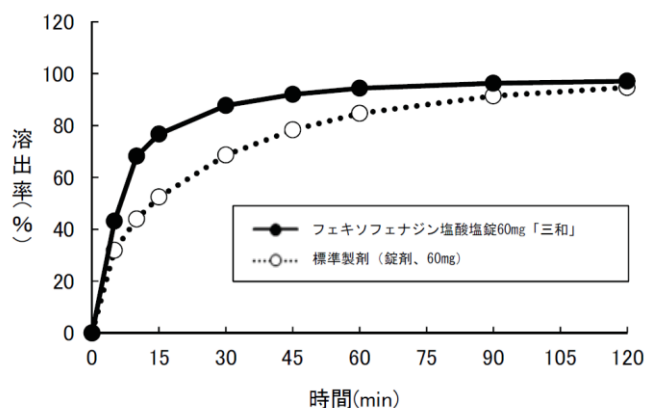
pH6.8、50rpm <判定基準：①>



水、50rpm <判定基準：①>



pH1.2、100rpm<判定基準：③a>



○溶出挙動

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「三和」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。

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「三和」：100錠 (PTP10錠×10)

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「三和」：100錠 (PTP10錠×10)、  
500錠 (PTP10錠×50)、  
100錠 (バラ)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP包装

PTP：ポリ塩化ビニル・ポリ塩化ビニリデン多層フィルム、アルミ箔

ピロー：ポリプロピレン・ポリエチレンラミネートフィルム

個装箱：紙

バラ包装

瓶：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

詰物：ポリエチレン

個装箱：紙

11. 別途提供される資材類

該当しない

## 12. 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. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

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。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

##### 〈蕁麻疹〉

##### ①国内第3相試験（成人）

慢性蕁麻疹患者を対象とした二重盲検並行群間比較試験（解析対象214例）で、フェキソフェナジン塩酸塩1回10mg<sup>注1)</sup>又は60mgを1日2回、1週間経口投与したとき、かゆみ及び発疹の合計症状スコアの変化量は以下のとおりであった。

国内主要試験成績（症状スコア変化量 平均±SE）

投与群	症例数	投与前	変化量	検定（共分散分析）
10mg	74	5.68±0.25	-2.12±0.34	p=0.0042
60mg	68	6.40±0.21	-3.53±0.33	

上記試験は1回10mg、60mg、120mgの1日2回投与の3群比較で実施されたが、解析結果には10mgと60mgの比較のみを示した。

フェキソフェナジン塩酸塩 60mg 投与群の副作用発現率は25.3%（19/75例）であり、主な副作用は眠気10.7%（8/75例）及び倦怠感4.0%（3/75例）であった<sup>8,9)</sup>。

注1)成人における本剤の承認用量は1回60mg、1日2回である。

## ②海外第3相試験（成人）

慢性蕁麻疹患者を対象に実施したプラセボ対照二重盲検比較試験（解析対象439例）で、プラセボ又はフェキソフェナジン塩酸塩1回60mgを1日2回、4週間経口投与したとき、フェキソフェナジン塩酸塩はプラセボに比し平均かゆみスコアの有意な減少が示された。

海外主要試験成績（症状スコア変化量 平均±SE）

投与群	症例数	投与前	変化量	検定（共分散分析）
プラセボ	90	1.92±0.09	-0.47±0.07	p=0.0001
60mg	86	1.98±0.10	-1.07±0.07	

上記海外主要試験（12～15歳を含む）はプラセボを対照として4用量（1回20mg、60mg、120mg、240mg）を用いて1日2回投与の比較を行っているが、解析結果にはプラセボと60mgの比較のみを示した。

フェキソフェナジン塩酸塩 60mg 投与群の副作用発現率は21.3%（19/89例）であり、主な副作用は頭痛10.1%（9/89例）であった<sup>10,11)</sup>。

## 〈アレルギー性鼻炎〉

### ①国内第3相試験（成人）

季節性アレルギー性鼻炎患者を対象とした二重盲検並行群間用量比較試験（解析対象307例）で、プラセボ又はフェキソフェナジン塩酸塩1回60mgを1日2回、2週間経口投与したとき、くしゃみ発作、鼻汁、眼症状の合計症状スコアの変化量は以下のとおりであった。

国内主要試験成績（症状スコア変化量 平均±SE）

投与群	症例数	投与前	変化量	検定（共分散分析）
プラセボ	105	6.74±0.14	0.07±0.18	p=0.0244
60mg	100	6.64±0.14	-0.36±0.18	

上記試験はプラセボを対照として1回60mg、120mgの1日2回投与の3群比較で実施されたが、解析結果にはプラセボと60mgの比較のみを示した。

フェキソフェナジン塩酸塩 60mg 投与群の副作用発現率は9.9%（10/101例）であり、主な副作用は眠気及び白血球減少が各3.0%（3/101例）であった<sup>12)</sup>。

## ②海外第3相試験（成人）

秋季季節性アレルギー性鼻炎患者を対象に実施したプラセボ対照二重盲検比較試験（解析対象 570 例）で、プラセボ又はフェキソフェナジン塩酸塩 1 回 60mg を 1 日 2 回（二重盲検下で 14 日間）経口投与したとき、フェキソフェナジン塩酸塩はプラセボに比し症状スコアの有意な減少が示された。

海外主要試験成績（症状スコア変化量 平均±SE）

投与群	症例数	投与前	変化量	検定（共分散分析）
プラセボ	141	8.88±0.14	-1.56±0.20	p=0.0001
60mg	141	8.81±0.14	-2.64±0.20	

上記海外主要試験（12～15 歳を含む）はプラセボを対照として 3 用量（1 回 60mg、120mg、240mg）を用いて 1 日 2 回投与の比較を行っているが、解析結果にはプラセボと 60mg の比較のみを示した。

フェキソフェナジン塩酸塩 60mg 投与群の副作用発現率は 14.2%（20/141 例）であり、主な副作用は頭痛 2.8%（4/141 例）、めまい及び白血球減少が各 2.1%（3/141 例）であった<sup>13,14)</sup>。

## ③国内第3相試験（小児）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象に、フェキソフェナジン塩酸塩（7～11 歳は 1 回 30mg 1 日 2 回、12～15 歳は 1 回 60mg 1 日 2 回）又は対照薬としてケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ（1 回 1g 1 日 2 回）を 4 週間経口投与した二重盲検比較試験（解析対象 127 例）で、くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉の合計スコアの変化量において対照薬に対するフェキソフェナジン塩酸塩の非劣性が示された。

国内主要試験成績（スコア変化量 平均±SE）

投与群	症例数	投与前	変化量	解析結果（共分散分析） <sup>注2)</sup>
フェキソフェナジン塩酸塩	64	6.09±0.20	-2.06±0.19	差の点推定値：-0.227 95%片側信頼限界上限：0.172 (非劣性限界値=0.9)
ケトチフェンフマル酸塩	63	6.10±0.19	-1.83±0.20	

注2) 投与前スコア及び年齢層を共変量とした共分散分析を行い、調整済みの 2 群の差の点推定値及びその 95%片側信頼限界上限を示した。

フェキソフェナジン塩酸塩投与群の副作用発現率は 5.3%（4/75 例）であり、主な副作用は傾眠 2.7%（2/75 例）であった<sup>15)</sup>。

## 〈アトピー性皮膚炎〉

### ①国内第3相試験（成人）

アトピー性皮膚炎患者を対象としたプラセボ対照二重盲検比較試験（解析対象 400 例）で、プラセボ又はフェキソフェナジン塩酸塩 1 回 60mg を 1 日 2 回（二重盲検下で 1 週間）経口投与したとき、かゆみスコアの変化量は以下のとおりであった。

国内主要試験成績（症状スコア変化量 平均 [95%信頼区間]）

投与群	症例数	投与前	変化量	検定(共分散分析)
プラセボ	199	4.79 [4.68, 4.89]	-0.50 [-0.62, -0.38]	p=0.0005
60mg	201	4.68 [4.59, 4.78]	-0.75 [-0.88, -0.62]	

フェキソフェナジン塩酸塩 60mg 投与群の副作用発現率は 23.2% (48/207 例) であり、主な副作用は眠気 3.9% (8/207 例) 及び血清ビリルビン上昇 1.4% (3/207 例) であった<sup>16)</sup>。

②国内第3相試験（小児）

アトピー性皮膚炎患者を対象に、フェキソフェナジン塩酸塩（7～11 歳には 1 回 30mg を 1 日 2 回、12～15 歳には 1 回 60mg を 1 日 2 回）又は対照薬としてケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ（1 回 1g を 1 日 2 回）を 4 週間経口投与した二重盲検比較試験（解析対象 162 例）で、対照薬に対するフェキソフェナジン塩酸塩の非劣性が示された。

小児 国内主要試験成績（スコア変化量 平均±SE）

投与群	症例数	投与前	変化量	解析結果（共分散分析） <sup>注3)</sup>
フェキソフェナジン塩酸塩	77	2.32±0.05	-0.50±0.06	差の点推定値：0.050 95%片側信頼限界上限：0.185 (非劣性限界値=0.37)
ケトチフェンフマル酸塩	85	2.38±0.05	-0.58±0.06	

注3) 投与前スコア及び年齢層を共変量とした共分散分析を行い、調整済みの2群の差の点推定値及びその95%片側信頼限界上限を示した。

フェキソフェナジン塩酸塩の副作用発現率は 10.8% (9/83 例) であり、主な副作用は傾眠 3.6% (3/83 例) であった<sup>17,18)</sup>。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

## (7) その他

### 1) 精神運動能に対する影響

- ①健康成人にフェキソフェナジン塩酸塩 120mg<sup>注1)</sup>、第一世代の抗ヒスタミン薬及びプラセボを二重盲検、3 剤 3 期クロスオーバーでそれぞれ単回投与し、ワープロ入力試験に及ぼす影響を検討したとき、その影響は第一世代の抗ヒスタミン薬に比べ有意に小さく、プラセボと同様であった。
- ②健康成人にフェキソフェナジン塩酸塩 120mg、第二世代の抗ヒスタミン薬及びプラセボを二重盲検、クロスオーバーでそれぞれ単回投与し、ポジトロン放出断層撮影法 (PET) を用いて脳への移行性を検討した結果、フェキソフェナジンによる大脳皮質のヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体の占拠はほとんどみられなかった。また、視覚刺激反応時間検査においてプラセボと差がなかった。
- ③ブタクサアレルギー患者に、フェキソフェナジン塩酸塩 60mg、第一世代の抗ヒスタミン薬、アルコール及びプラセボを二重盲検、4 剤 4 期クロスオーバーでそれぞれ単回投与し、シミュレーター上での自動車運転能力に及ぼす影響を検討したとき、運転能力に及ぼす影響は第一世代の抗ヒスタミン薬に比べ有意に小さく、プラセボと同様であった<sup>19-21)</sup> (外国人データ)。

### 2) 心血管系へ及ぼす影響

- ①成人の季節性アレルギー性鼻炎患者にフェキソフェナジン塩酸塩を 1 回 240mg まで 1 日 2 回<sup>注1)</sup> 2 週間投与したとき、プラセボと比較して、QTc 間隔の有意な変化は見られなかった<sup>14, 22)</sup> (外国人データ)。
- ②健康成人にフェキソフェナジン塩酸塩を 1 回 60mg 1 日 2 回 6 ヶ月、1 回 400mg 1 日 2 回 1 週間及び 240mg 1 日 1 回 1 年間投与しても、プラセボに比して、QTc 間隔の有意な変動はみられなかった<sup>23-26)</sup> (外国人データ)。
- ③健康成人男性を対象にしたエリスロマイシンとの薬物相互作用の検討 (フェキソフェナジン塩酸塩 1 回 120mg 1 日 2 回 7 日間、エリスロマイシン 1 回 300mg 1 日 4 回 7 日間) において、併用により血漿中フェキソフェナジン塩酸塩濃度が約 2 倍に上昇した場合でも QTc などの心電図を含め安全性に問題はみられなかった<sup>27)</sup>。[「VIII. 7. (2) 併用注意とその理由」、「VII. 1. (4) 2) 併用薬の影響①」の項参照]
- ④C<sub>max</sub> が承認用量投与時の 10 倍以上となる条件下での検討において、心電図への影響はなく、有害事象の増加も認められなかった<sup>24)</sup> (外国人データ)。
- ⑤フェキソフェナジン塩酸塩にはクローン化したヒト心筋遅延整流 K<sup>+</sup>チャンネルに対する影響は認められていない<sup>28)</sup>。

注 1) 成人における本剤の承認用量は 1 回 60mg、1 日 2 回である。

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理学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

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

フェキソフェナジン塩酸塩は、選択的ヒスタミン  $H_1$  受容体拮抗作用を主作用とし、加えて炎症性サイトカイン遊離抑制作用、好酸球遊走抑制作用及び各種ケミカルメディエーター遊離抑制作用を示す<sup>29)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) ヒスタミン $H_1$ 受容体拮抗作用

フェキソフェナジン塩酸塩は、ヒスタミン  $H_1$  受容体においてヒスタミンと拮抗し、モルモット摘出回腸標本及び気管標本におけるヒスタミン誘発収縮を抑制した ( $10^{-7}$ ~ $3 \times 10^{-6}$ M)。また、全身投与でモルモット・ヒスタミン誘発気道収縮及び皮膚反応を抑制した<sup>30)</sup>。なお、フェキソフェナジン塩酸塩にはアドレナリン、アセチルコリン、セロトニン及びタキキニンの各受容体並びにL型カルシウムチャンネルに対する親和性は認められていない<sup>31)</sup>。

##### 2) 好酸球、炎症性サイトカイン及び細胞接着分子に対する作用

フェキソフェナジン塩酸塩は、季節性アレルギー性鼻炎患者由来鼻粘膜上皮細胞培養上清により誘発されるヒト好酸球の遊走を  $10^{-6}$ M 以上で抑制した。また、季節性アレルギー性鼻炎患者由来鼻粘膜上皮細胞を活性化ヒト好酸球とともに培養したときに培養上清中に遊離される炎症性サイトカインである IL-8 及び GM-CSF をそれぞれ  $10^{-6}$ M 以上及び  $10^{-9}$ M 以上で抑制し、細胞接着分子である sICAM-1 を  $10^{-9}$ M 以上で減少させた<sup>32)</sup>。

##### 3) ケミカルメディエーター遊離抑制作用

フェキソフェナジン塩酸塩は、健康成人の末梢血好塩基球及びアトピー性皮膚炎患者の末梢血白血球からの抗ヒト IgE 抗体刺激によるヒスタミン遊離を抑制した ( $10^{-6}$ ~ $10^{-5}$ M)。また、モルモット抗原誘発即時型喘息モデルにおいて気管支肺胞洗浄液 (BALF) 中のロイコトリエン量を減少させた<sup>33)</sup>。

##### 4) I 型アレルギー病態モデル動物に対する作用

フェキソフェナジン塩酸塩は、モルモット抗原誘発アレルギー性鼻炎、ラット受身皮膚アナフィラキシー (PCA) 反応、ラット抗原誘発全身性アナフィラキシー反応及びモルモット抗原誘発即時型喘息反応を抑制した<sup>34)</sup>。

#### (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

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 1) 成人

健康成人男性8例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル60mg<sup>注1)</sup>を空腹時単回経口投与したとき、血漿中フェキソフェナジン濃度パラメータは以下のとおりであった。反復投与時には蓄積傾向はみられなかった<sup>35)</sup>。

注1) フェキソフェナジン塩酸塩カプセルとフェキソフェナジン塩酸塩錠60mgは生物学的に同等であった<sup>36)</sup>。

血漿中濃度パラメータ

投与量	AUC <sub>0-∞</sub> (ng・h/mL)	t <sub>max</sub> (h)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>1/2</sub> (h)	CL/F (L/h)
60mg	1445 (35.8)	2.2 (38.5)	248 (45.0)	9.6 (59.5)	44.4 (41.1)
120mg	3412 (28.4)	1.9 (37.0)	564 (39.1)	13.8 (64.9)	35.0 (26.7)

平均 (変動係数%)

##### 2) 小児

通年性アレルギー性鼻炎患者にフェキソフェナジン塩酸塩錠30mg (7~11歳:50例)及び60mg (12~15歳:19例)を1日2回28日間反復経口投与したとき、最終回投与時のフェキソフェナジン塩酸塩の血漿中濃度パラメータは以下のとおりであった<sup>37,38)</sup>。

血漿中濃度パラメータ

対象患者	年齢 (歳)	投与 量	症例 数	AUC <sub>0-∞</sub> (ng・h/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>1/2</sub> (h)	CL/F (L/h)
日本人小児 患者 <sup>注2)</sup>	7-11	30mg	50	851 (38.2)	150 (51.7)	15.8 (68.4)	40.1 (36.4)
	12-15	60mg	19	1215 (22.1)	185 (41.8)	12.3 (75.0)	51.6 (21.1)
外国人小児 患者 <sup>注3)</sup> (参考:単回 経口投与)	7-12	30mg	14	1091 (36.7)	184 (48.1)	8.8 (34.5)	29.1 (36.3)

平均 (変動係数%)

各パラメータの算出方法

注2)NONMEMによるベイズ推定、注3)ノンコンパートメント解析

### 3) 生物学的同等性試験

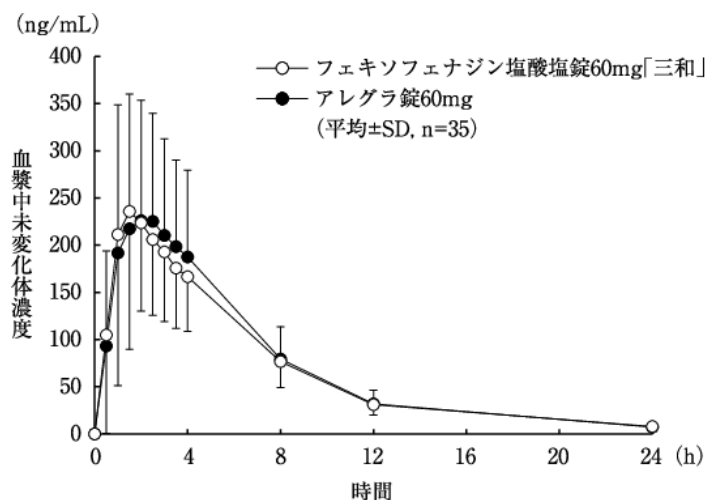
#### ① フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」<sup>39)</sup>

平成9年12月22日付医薬審第487号厚生省医薬安全局審査管理課長通知「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインについて」及び平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知「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について」に基づき実施した。

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「三和」とアレグラ錠60mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（フェキソフェナジン塩酸塩として60mg）健康成人男性35例に絶食単回経口投与し、LC/MS/MS法により血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、 $C_{max}$ ）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $AUC_{0-24}$  及び $C_{max}$ の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、それぞれ $\log(0.8822) \sim \log(1.1081)$  及び $\log(0.8388) \sim \log(1.1593)$ であり、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であることから両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0-24}$ (ng・h/mL)	$C_{max}$ (ng/mL)	$t_{max}$ (h)	$t_{1/2}$ (h)
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」	1651 ± 536	277.4 ± 131.6	2.0 ± 1.4	4.93 ± 0.81
アレグラ錠 60mg	1718 ± 773	279.5 ± 138.1	1.9 ± 0.9	4.62 ± 0.93

(平均±SD, n=35)



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。

#### ② フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」<sup>40)</sup>

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「三和」は、平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知「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について」の「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「三和」を標準剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

### (3) 中毒域

該当資料なし

## (4) 食事・併用薬の影響

### 1) 食事の影響

健康成人男性 22 例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<sup>注4)</sup>を単回経口投与したとき、空腹時に比べ食後投与時の  $AUC_{0-\infty}$ 及び  $C_{max}$  はそれぞれ 15%及び 14%減少した<sup>41)</sup>（外国人データ）。

### 2) 併用薬の影響

#### ① エリスロマイシン

健康成人男性 18 例にフェキソフェナジン塩酸塩円形錠<sup>注5)</sup> 1回 120mg1日2回<sup>注4)</sup>とエリスロマイシン 1回 300mg1日4回7日間併用して反復経口投与したとき、血漿中フェキソフェナジンの  $C_{max}$  はフェキソフェナジン塩酸塩単独投与時の約 2 倍に上昇した。一方、血漿中エリスロマイシン濃度には、併用による影響はなかった。

この血漿中フェキソフェナジン濃度上昇の機序は動物試験から、P 糖蛋白の阻害によるフェキソフェナジン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た<sup>27, 42, 43)</sup>。[「VIII. 7. (2) 併用注意とその理由」、「V. 5. (7)2) 心血管系へ及ぼす影響③」の項参照]

#### ② 水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウム含有製剤

健康成人男性 22 例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル 120mg<sup>注4)</sup>の投与 15 分前に水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウム含有製剤を単回投与したとき、フェキソフェナジンの  $AUC_{0-30}$  及び  $C_{max}$  はフェキソフェナジン塩酸塩単独投与時の約 40%減少した<sup>44)</sup>（外国人データ）。[「VIII. 7. (2) 併用注意とその理由」の項参照]

#### ③ ケトコナゾール

健康成人男性 23 例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル 1回 120mg1日2回<sup>注4)</sup>とケトコナゾール錠 400mg1日1回7日間併用して反復経口投与したとき、血漿中フェキソフェナジン濃度はフェキソフェナジン塩酸塩単独投与時の約 2 倍に上昇したが、血漿中ケトコナゾール濃度には、併用による影響はなかった。血漿中フェキソフェナジン濃度上昇の機序はエリスロマイシンと同様と推定された<sup>45)</sup>（外国人データ）。

#### ④ オメプラゾール

健康成人男性 23 例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル 120mg<sup>注4)</sup>の投与 11 時間前と 1 時間前にオメプラゾールカプセルをそれぞれ 20mg 及び 40mg を単回投与したとき、フェキソフェナジン塩酸塩の薬物動態に影響はなかった<sup>46)</sup>（外国人データ）。

注 4) 成人における本剤の承認用量は 1 回 60mg、1 日 2 回である。

注 5) フェキソフェナジン塩酸塩円形錠とフェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg は生物学的に同等であった<sup>47)</sup>。

## 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) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

「VII. 1. (4) 食事・併用薬の影響」の項参照

5. 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

(6) 血漿蛋白結合率

健康成人にフェキソフェナジン塩酸塩 40、200 及び 400mg<sup>注4)</sup>を 1 日 2 回経口投与したとき、投与後 1 時間及び 12 時間のフェキソフェナジンの *in vivo* における血漿蛋白との結合率は、13~7359ng/mL の濃度範囲で 60~82% (69.4±5.9%) であった<sup>48)</sup>。

注 4)成人における本剤の承認用量は 1 回 60mg、1 日 2 回である。

## 6. 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 (CYP 等) の分子種, 寄与率

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活性比, 存在比率

該当資料なし

## 7. 排泄

健康成人男性 8 例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル 60mg を単回経口投与したときの投与後 48 時間までの尿中フェキソフェナジンの平均累積回収率は、11.1%であった。

健康成人男性に <sup>14</sup>C-フェキソフェナジン塩酸塩溶液 60mg を単回経口投与したとき、投与後 11 日までの尿及び糞中の回収率は 91.5%で、放射能を示す分画のほとんどはフェキソフェナジンであり、糞中に約 80%、尿中に約 11.5%排泄された<sup>49,50)</sup> (外国人データ)。

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9. 透析等による除去率

本剤は血液透析によって除去できない。(「VIII. 10. 過量投与」の項参照)

## 10. 特定の背景を有する患者

### (1)腎機能障害患者

成人の腎機能障害患者 29 例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル 80mg<sup>注 4)</sup> を単回投与したとき、クレアチニンクリアランス 41~80mL/min 及び 11~40mL/min の患者におけるフェキソフェナジンの  $C_{max}$  は健康成人に比し、それぞれ 1.5 倍及び 1.7 倍高く、平均消失半減期はそれぞれ 1.6 倍及び 1.8 倍長かった。また、透析患者 (クレアチニンクリアランス: 10mL/min 以下) におけるフェキソフェナジンの  $C_{max}$  は健康成人に比し、1.5 倍高く、平均消失半減期は 1.4 倍長かった。なお、忍容性は良好であった<sup>51,52)</sup> (外国人データ)。

### (2)肝機能障害患者

成人の肝機能障害患者 17 例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル 80mg<sup>注 4)</sup> を単回投与したとき、肝機能障害患者におけるフェキソフェナジンの薬物動態は、被験者間の分散も大きく、肝障害の程度による体内動態の差はみられなかった。Child-Pugh 分類で B 又は C1 であった患者のフェキソフェナジンの  $AUC_{0-\infty}$  は 2176ng・h/mL、 $C_{max}$  は 281ng/mL、 $t_{1/2}$  は 16.0h であった。こ

これらの値は健康若年者における値のそれぞれ 1.2、1.1、1.2 倍であった。なお、忍容性は良好であった<sup>53,54)</sup> (外国人データ)。

### (3) 高齢者

65 歳以上の健康高齢者 20 例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル 80mg<sup>注4)</sup>を単回投与したときのフェキソフェナジンの  $AUC_{0-\infty}$  は 2906ng・h/mL、 $C_{max}$  は 418ng/mL、 $t_{1/2}$  は 15.2h であった。これらの値は健康若年者における値のそれぞれ 1.6、1.6、1.1 倍であった。なお、忍容性は良好であった<sup>55,56)</sup> (外国人データ)。[「VIII. 6. (8) 高齢者」の項参照]

注4)成人における本剤の承認用量は1回60mg、1日2回である。

### 11. その他

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

設定されていない

### 2. 禁忌内容とその理由

#### 2. 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注意とその理由

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 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。

〈アレルギー性鼻炎〉

8.2 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。

### 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### (1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

#### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

#### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

#### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

#### (5) 妊婦

#### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

## (6)授乳婦

### 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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。

## (7)小児等

### 9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児、幼児を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

## (8)高齢者

### 9.8 高齢者

異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。腎機能が低下していることが多く、血中濃度が上昇する場合がある。[16.6.3 参照]

## 7. 相互作用

### (1)併用禁忌とその理由

設定されていない

### (2)併用注意とその理由

#### 10.2 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
エリスロマイシン [16.7.1、17.3.2 参照]	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。
水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウム含有製剤 [16.7.2 参照]	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。
アパルタミド	本剤の血漿中濃度が低下し、作用が減弱するおそれがある。	P糖蛋白の誘導により、本剤の血漿中濃度が低下したとの報告がある。

## 8. 副作用

### 11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

## (1) 重大な副作用と初期症状

### 11.1 重大な副作用

#### 11.1.1 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

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。

#### 11.1.2 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

AST、ALT、 $\gamma$ -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。

#### 11.1.3 無顆粒球症（頻度不明）、白血球減少（0.2%）、好中球減少（0.1%未満）

## (2) その他の副作用

### 11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	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	そう痒	蕁麻疹、潮紅、発疹	血管浮腫
肝臓	AST上昇、ALT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	

発現頻度は使用成績調査を含む

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

### 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

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。

## 10. 過量投与

### 13. 過量投与

#### 13.1 症状

外国での過量投与症例として高用量を服用した2例の報告があり、1800mgを服用した症例では症状はなく、3600mgを服用した症例では、めまい、眠気及び口渇がみられた。

#### 13.2 処置

本剤は血液透析によって除去できない。

## 11. 適用上の注意

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

### (2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

## 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」の項参照

#### (2) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

#### (4) がん原性試験

該当資料なし

#### (5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

#### (7) 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 「三和」  
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」 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

有効期間：3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

設定されていない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無し  
くすりのしおり：有り  
その他の患者向け資材：無し

### 6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：アレグラ錠 30mg、アレグラ錠 60mg

### 7. 国際誕生年月日

該当資料なし

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
フェキソフェナジン 塩酸塩錠 30mg 「三和」	2013年2月15日	22500AMX00192000	2013年6月21日	2013年6月21日
フェキソフェナジン 塩酸塩錠 60mg 「三和」	2013年2月15日	22500AMX00191000	2013年6月21日	2013年6月21日

### 9. 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

### 10. 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

#### 1 1. 再審査期間

該当しない

#### 1 2. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

#### 1 3. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT(9桁)番号	レセプト電算処理 システム用コード
フェキソフェナジン 塩酸塩錠 30mg 「三和」	4490023F2179	4490023F2179	122512901	622251201
フェキソフェナジン 塩酸塩錠 60mg 「三和」	4490023F1016	4490023F1172	122513601	(統一名) 622475700 (販売名) 622251301

#### 1 4. 保険給付上の注意

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」:

令和 8 年 3 月 5 日保医発 0305 第 12 号により、令和 8 年 4 月 1 日以降は、診療報酬において加算等の算定対象となる後発医薬品から除外された。(診療報酬における加算等の算定対象とならない後発医薬品として取り扱う)

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」:

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## X I . 文献

### 1. 引用文献

- 1) 第十八改正日本薬局方解説書, 廣川書店. 2021 ; C-4567-4571
- 2) 社内資料 : フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg 「三和」 加速試験
- 3) 社内資料 : フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg 「三和」 加速試験
- 4) 社内資料 : フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg 「三和」 無包装状態の安定性
- 5) 社内資料 : フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg 「三和」 無包装状態の安定性
- 6) 社内資料 : フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg 「三和」 溶出試験
- 7) 社内資料 : フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg 「三和」 溶出試験
- 8) Kawashima M, et al. : Int Arch Allergy Immunol. 2001 ; 124 (1-3) : 343-345
- 9) 慢性蕁麻疹患者における用量探索試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ト. II. 1. (1) )
- 10) Finn A F, et al. : J Allergy Clin Immunol. 1999 ; 104 (5) : 1071-1078 (PMID:10550755)
- 11) 慢性蕁麻疹患者におけるプラセボ対照二重盲検用量比較試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ト. IV. 1. (1) )
- 12) 季節性アレルギー鼻炎患者における用量比較試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ト. II. 2. (2) )
- 13) Bernstein D I, et al. : Ann Allergy Asthma Immunol. 1997 ; 79 (5) : 443-448 (PMID:9396979)
- 14) 季節性アレルギー鼻炎患者におけるプラセボ対照二重盲検用量比較試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ト. IV. 2. (1) )
- 15) 馬場廣太郎 : 耳鼻咽喉科臨床. 2007 ; 100 (2) 補冊 (119) : 1-20
- 16) Kawashima M, et al. : Br J Dermatol. 2003 ; 148 (6) : 1212-1221 (PMID:12828751)
- 17) 中川秀己 他 : 西日本皮膚科. 2006 ; 68 (5) : 553-565
- 18) 小児のアトピー性皮膚炎患者におけるフマル酸ケトチフェン対照二重盲検比較試験 (アレグラ錠 : 2006年10月20日承認、申請資料概要2. 7. 6. (2) )
- 19) 浦江明憲 他 : 臨床薬理. 2000 ; 31 (5) : 649-658
- 20) Tashiro M, et al. : J Clin Pharmacol. 2004 ; 44 (8) : 890-900 (PMID:15286093)
- 21) Weiler J M, et al. : Ann Intern Med. 2000 ; 132 : 354-363 (PMID:10691585)
- 22) Pratt C M, et al. : Am J Cardiol. 1999 ; 83 : 1451-1454 (PMID:10335761)
- 23) Pratt C, et al. : Clin Exp Allergy. 1999 ; 29 (Suppl. 3) : 212-216 (PMID:10444240)
- 24) 高用量における心電図の検討試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III. 3. (1) 、ト. I. 5. (4) )
- 25) 健康成人12ヵ月長期投与試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ト. V. 1. (1) )
- 26) 健康成人6ヵ月長期投与試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ト. V. 1. (2) )
- 27) エリスロマイシンとの相互作用 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III. 2. (1) 、ト. I. 5. (1) )
- 28) QTc間隔延長の可能性に関する検討 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ホ. II. 2. (1) )
- 29) 効力を裏付ける試験の総括 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ホ. I )
- 30) 抗ヒスタミン作用 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ホ. I. 2. (1) )

- 3 1) 他の受容体及びイオンチャネルに対する親和性 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ホ. I.2. (4) )
- 3 2) Abdelaziz M M, et al. : J Allergy Clin Immunol. 1998 ; 101 : 410-420 (PMID:9525460)
- 3 3) ケミカルメディエーター遊離抑制作用 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ホ. I.2. (2))
- 3 4) 病態モデル動物に対する作用 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ホ. I.1)
- 3 5) 健康成人における薬物動態 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III. 1. (1) )
- 3 6) 生物学的同等性試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III. 4. (1) )
- 3 7) 小児における薬物動態 (アレグラ錠 : 2006年10月20日承認、申請資料概要2.5.3. (2) )
- 3 8) 小児の通年性アレルギー性鼻炎に対するフマル酸ケトチフェン対照二重盲検比較試験 (アレグラ錠 : 2006年10月20日、申請資料概要2.7.6. (2) )
- 3 9) 社内資料 : フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg 「三和」 生物学的同等性試験
- 4 0) 社内資料 : フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg 「三和」 生物学的同等性試験
- 4 1) 食事の影響 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III. 1. (1) .2) )
- 4 2) 浦江明憲 他 : 臨床薬理. 2000 ; 31 (5) : 639-648
- 4 3) イヌ (*in vivo*) における薬物相互作用 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. II.5. (3) )
- 4 4) 水酸化アルミニウムゲル・水酸化マグネシウムとの相互作用 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III.2. (4) )
- 4 5) ケトコナゾールとの相互作用 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III.2. (2) )
- 4 6) オメプラゾールとの相互作用 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III.2. (3) )
- 4 7) 生物学的同等性試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III.4. (2) )
- 4 8) 健康成人における蛋白結合 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. II.2. (4) )
- 4 9) 健康成人における尿中排泄 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III.1. (2) )
- 5 0) 健康成人における代謝 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III.1. (3) )
- 5 1) 腎機能障害患者における薬物動態 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III.3. (4) )
- 5 2) 腎機能障害患者における安全性の検討試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ト. V.2. (2) )
- 5 3) 肝機能障害患者における薬物動態 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III.3. (3) )
- 5 4) 肝機能障害患者における安全性の検討試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ト. V.2. (3) )
- 5 5) 高齢者における薬物動態 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要へ. III.3. (2) )
- 5 6) 高齢者における安全性の検討試験 (アレグラ錠 : 2000年9月22日承認、申請資料概要ト. V.2. (1) )
- 5 7) Therapeutic Goods Administration, Prescribing medicines in pregnancy database  
 <<https://www.tga.gov.au/resources/health-professional-information-and-resources/australian-categorisation-system-prescribing-medicines-pregnancy/prescribing-medicines-pregnancy-database>> (2026/05/18アクセス)
- 5 8) American Academy of Pediatrics : Pediatrics. 2001 ; 108 : 776

## 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

- (1) 本剤と同一製剤は外国で発売されていない。
- (2) フェキソフェナジン塩酸塩製剤としては、各国で販売されている。

### 2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（FDA分類、オーストラリアの分類）<sup>57)</sup>

本邦における電子添文の特定の背景を有する患者に関する注意「9.5妊婦」の項の記載は以下のとおりであり、米FDA分類、オーストラリアの分類とは異なる。

特定の背景を有する患者に関する注意

#### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

	分類
FDA : Pregnancy Category	C (2008年)
オーストラリアの分類 : An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy	B2 (2026年5月現在)

参考：分類の概要

<FDA : Pregnancy Category>

C : Either studies in animals have revealed adverse effects on the fetus (teratogenic or embryocidal or other) and there are no controlled studies in women or studies in women and animals are not available. Drugs should be given only if the potential benefit justifies the potential risk to the fetus.

[動物を用いた研究では、薬物に催奇形性、または胎児（芽）致死作用が証明されており、ヒト妊婦での対照比較研究は実施されていないもの。あるいはヒト妊婦、動物ともに研究が入手できないもの。]

<オーストラリアの分類 : An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy>

B2 : Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed. Studies in animals are inadequate or may be lacking, but available data show no evidence of an increased occurrence of fetal damage.

[妊婦および妊娠可能年齢の女性への使用経験はまだ限られているが、この薬による奇形やヒト胎児への直接・間接的有害作用の発生頻度増加は観察されていない。動物を用いた研究は不十分または欠如しているが、入手しうるデータは胎児への障害の発生が増加したという証拠は示されていない。]

授乳婦（乳児）に関する海外情報（米國小児科学会(AAP)の分類基準)<sup>58)</sup>

本邦における電子添文の特定の背景を有する患者に関する注意「9.6授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、米國小児科学会(AAP)の分類基準とは異なる。

特定の背景を有する患者に関する注意

#### 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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。

<米國小児科学会(AAP: American Academy of Pediatrics)の分類基準(2001年9月)>

Maternal Medication Usually Compatible With Breastfeeding

[母親への薬物療法は一般に授乳と両立しうる。]

### XⅢ. 備考

#### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

##### (1) 粉碎

参考情報については、表紙に記載の問い合わせ窓口にて個別に照会すること。

##### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

参考情報については、表紙に記載の問い合わせ窓口にて個別に照会すること。

#### 2. その他の関連資料

該当資料なし