

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

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

(日本薬局方 フェキソフェナジン塩酸塩錠) Tab. 30mg “SANWA”

Tab. 60mg “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30mgを含有 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60mgを含有 |
| 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・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：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 コントクトセンター TEL 0120-19-8130 FAX(052)950-1305 医療関係者向けホームページ http://med.skk-net.com/ |

本 IF は 2013 年 6 月改訂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、医薬品医療機器情報提供ホームページ<http://www.info.pmda.go.jp/>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もの 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、「IF 記載要領 2008」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 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、「IF 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 IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 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、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR 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 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

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、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. 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 | |
| 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，略名，記号番号 | 2 |
| 7. CAS 登録番号 | 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 | 3 |
| 4. 有効成分の定量法 | 3 |
| IV. 製剤に関する項目 | |
| 1. 剤形 | 4 |
| 2. 製剤の組成 | 4 |
| 3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 | 5 |
| 4. 製剤の各種条件下における安定性 | 5 |
| 5. 調製法及び溶解後の安定性 | 5 |
| 6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） | 5 |
| 7. 溶出性 | 5 |
| 8. 生物学的試験法 | 9 |
| 9. 製剤中の有効成分の確認試験法 | 9 |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法 | 9 |
| 11. 力価 | 9 |
| 12. 混入する可能性のある夾雑物 | 9 |
| 13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 | 9 |
| 14. その他 | 9 |
| V. 治療に関する項目 | |
| 1. 効能又は効果 | 10 |
| 2. 用法及び用量 | 10 |
| 3. 臨床成績 | 10 |
| 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 | 12 |
| 2. 薬理作用 | 12 |
| VII. 薬物動態に関する項目 | |
| 1. 血中濃度の推移・測定法 | 13 |
| 2. 薬物速度論的パラメータ | 14 |

| | | |
|--------------------------|--------------------------------|----|
| 3. | 吸収 | 14 |
| 4. | 分布 | 15 |
| 5. | 代謝 | 15 |
| 6. | 排泄 | 15 |
| 7. | 透析等による除去率 | 16 |
| 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 | 17 |
| 2. | 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） | 17 |
| 3. | 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 | 17 |
| 4. | 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 | 17 |
| 5. | 慎重投与内容とその理由 | 17 |
| 6. | 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 | 17 |
| 7. | 相互作用 | 17 |
| 8. | 副作用 | 18 |
| 9. | 高齢者への投与 | 18 |
| 10. | 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 | 19 |
| 11. | 小児等への投与 | 19 |
| 12. | 臨床検査結果に及ぼす影響 | 19 |
| 13. | 過量投与 | 19 |
| 14. | 適用上の注意 | 19 |
| 15. | その他の注意 | 19 |
| 16. | その他 | 19 |
| IX. 非臨床試験に関する項目 | | |
| 1. | 薬理試験 | 20 |
| 2. | 毒性試験 | 20 |
| X. 管理的事項に関する項目 | | |
| 1. | 規制区分 | 21 |
| 2. | 有効期間又は使用期限 | 21 |
| 3. | 貯法・保存条件 | 21 |
| 4. | 薬剤取扱い上の注意点 | 21 |
| 5. | 承認条件等 | 21 |
| 6. | 包装 | 21 |
| 7. | 容器の材質 | 21 |
| 8. | 同一成分・同効薬 | 22 |
| 9. | 国際誕生年月日 | 22 |
| 10. | 製造販売承認年月日及び承認番号 | 22 |
| 11. | 薬価基準収載年月日 | 22 |
| 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 | 22 |
| 13. | 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 | 22 |
| 14. | 再審査期間 | 22 |
| 15. | 投薬期間制限医薬品に関する情報 | 22 |
| 16. | 各種コード | 23 |

| | |
|-----------------|----|
| 17. 保険給付上の注意 | 23 |
| X I. 文献 | |
| 1. 引用文献 | 24 |
| 2. その他の参考文献 | 24 |
| X II. 参考資料 | |
| 1. 主な外国での発売状況 | 25 |
| 2. 海外における臨床支援情報 | 25 |
| X III. 備考 | |
| その他の関連資料 | 27 |

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 H₁ 受容体拮抗作用を有し、抗アレルギー薬に分類される¹⁾。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・製剤学的特性

- (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 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¹⁾。
- (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. (2) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

II. 名称に関する項目

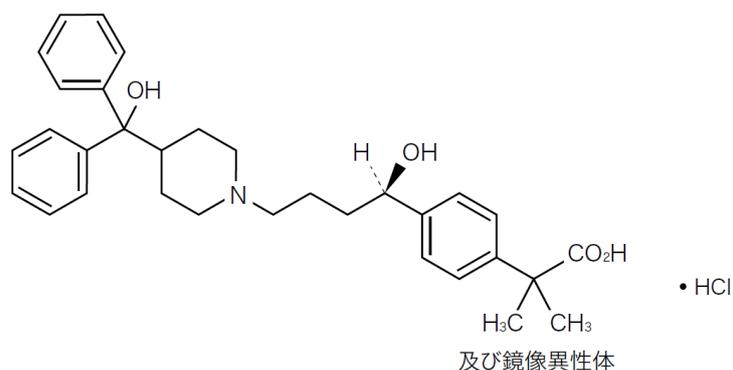
1. 販売名

- (1) 和名：フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」
- (2) 洋名：FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE Tab. 30mg “SANWA”
FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE Tab. 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：不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₃₂H₃₉N₀₄•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，略名，記号番号

該当資料なし

7. CAS 登録番号

153439-40-8 (Fexofenadine Hydrochloride)

83799-24-0 (Fexofenadine)

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 | 極めて溶けやすい |
| エタノール(99.5) | 10mL 以上 30mL 未満 | やや溶けやすい |
| 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

「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。

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準拠する。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別, 規格及び性状

1) 区別: フィルムコーティング錠

2) 規格:

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」

| | 表 | 裏 | 側面 |
|-------|---|---|---|
| 外形 |  |  |  |
| 識別コード | 直径(mm) | 厚さ(mm) | 重量(mg) |
| Sc448 | 6.6 | 3.3 | 104 |

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」

| | 表 | | 裏 | | 側面 |
|-------|---|--------|---|--------|---|
| 外形 |  | |  | |  |
| 識別コード | 長径(mm) | 短径(mm) | 厚さ(mm) | 重量(mg) | |
| Sc449 | 12.1 | 5.6 | 3.9 | 206 | |

3) 性状:

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「三和」はうすいだい色のフィルムコーティング錠である。

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「三和」はうすいだい色のフィルムコーティング錠である。

(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 「三和」 : Sc448

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」 : Sc449

(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 「三和」 :

1錠中「日局」フェキソフェナジン塩酸塩 30mg を含有

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 60mg を含有

(2) 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、フマル酸ステア
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、黄色三二酸化鉄を含有する。

(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

加速試験^{2,3)}

| 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 ヵ月 | PTP 包装 | 変化なし | 変化なし |
| | | | バラ包装 (ポリエチレン瓶) | | 変化なし |

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。

5. 調製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）

該当しない

7. 溶出性

(1) フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「三和」⁴⁾

○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

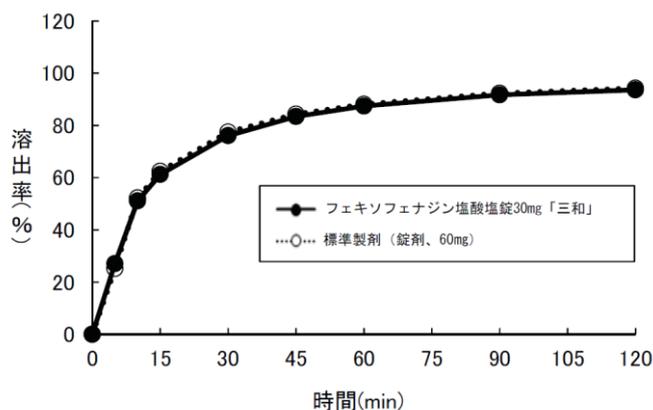
a. 規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあるか、又はf2関数の値は50以上である。

(2)個々の溶出率

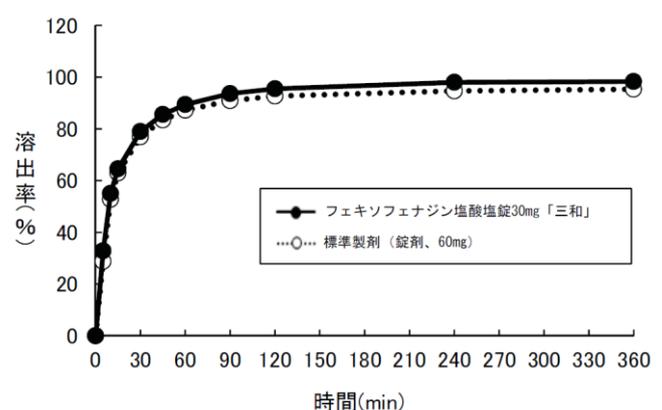
a. 標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

結果：溶出性は判定基準に適合した。

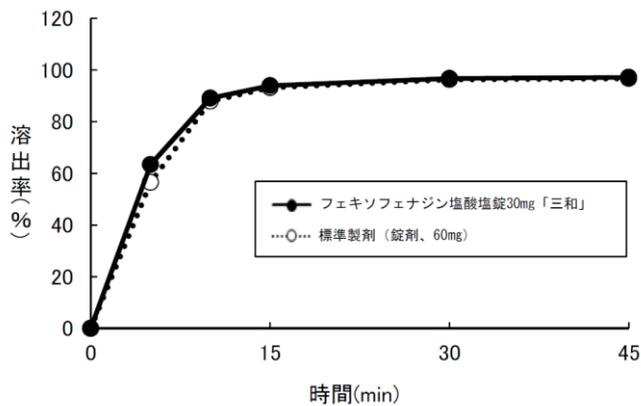
pH1.2、50rpm<判定基準：③a>



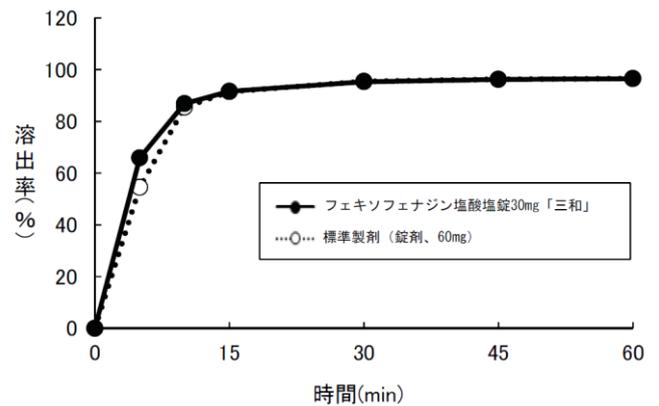
pH4.0、50rpm<判定基準：③a>



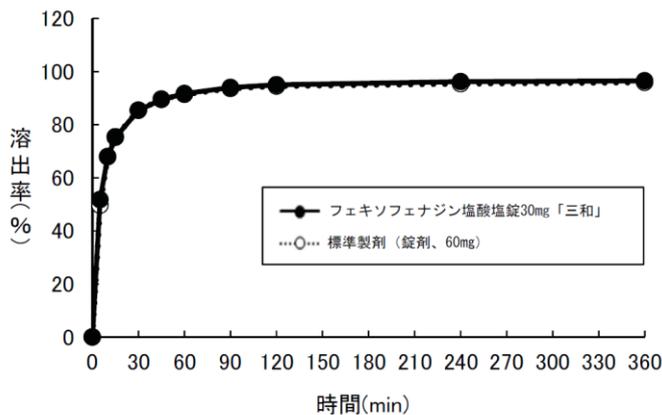
pH6.8、50rpm <判定基準：①>



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」⁵⁾

○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

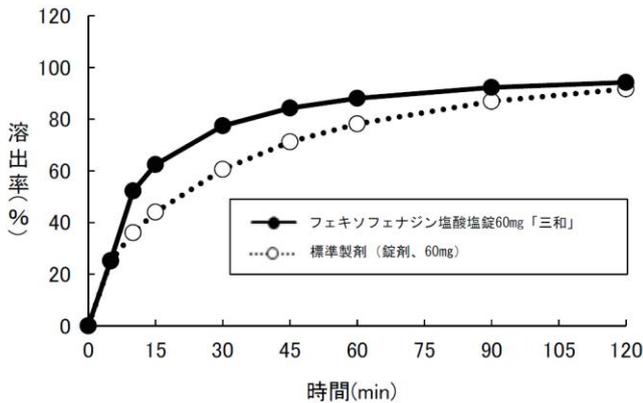
試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

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。

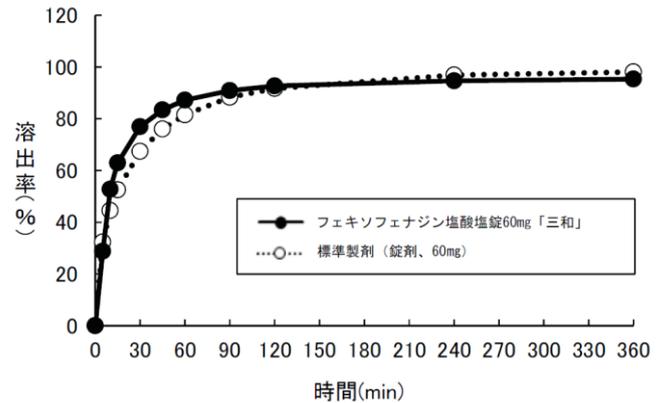
- a. 規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値は 42 以上である。

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。

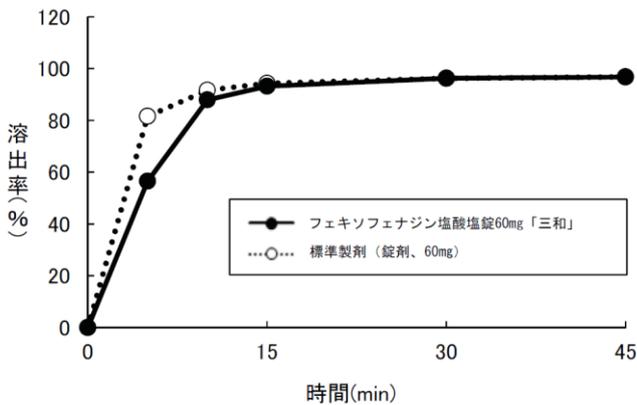
pH1.2、50rpm <判定基準：③a>



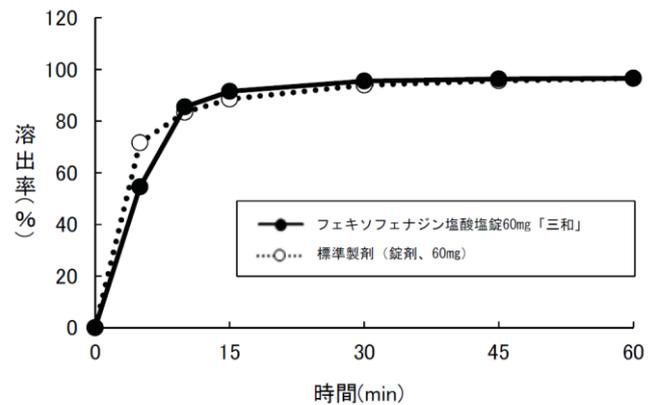
pH4.0、50rpm <判定基準：③a>



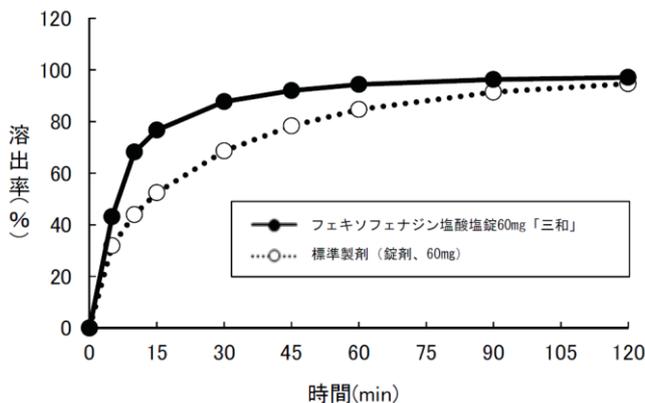
pH6.8、50rpm <判定基準：①>



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。

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

「日局」フェキソフェナジン塩酸塩錠の確認試験法に準拠する。

10. 製剤中の有効成分の定量法

「日局」フェキソフェナジン塩酸塩錠の定量法に準拠する。

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物^{2,3)}

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

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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ（2009年4月以降承認品目）

◎：評価資料、○：参考資料、－：非検討もしくは評価の対象とせず

| | 対象 | 有効性 | 安全性 | 薬物動態 | 概要 |
|---------------------------------------|-----------------|-----|-----|------|-------------------------|
| フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」 ⁶⁾ | 健康成人男子 (日本人) | － | ○ | ◎ | 絶食単回経口投与時の 生物学的同等性試験 |

(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）

該当しない

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¹⁾

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。

(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⁾

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」 : 2.0 ± 1.4 (h) (Mean \pm S. D., n=35)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

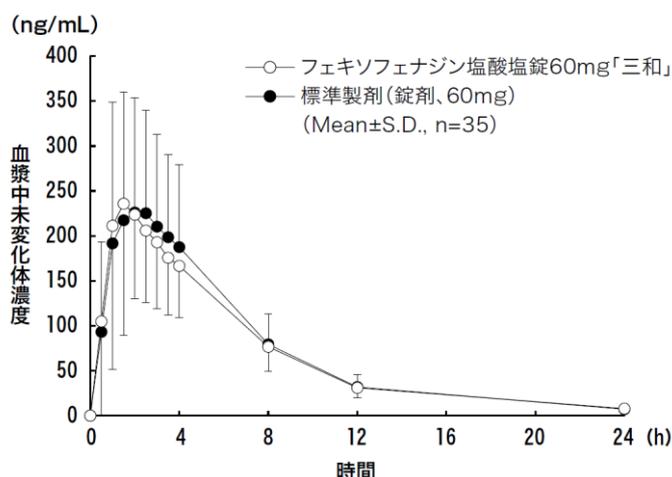
1) フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」⁶⁾

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」と標準製剤（錠剤、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）健康成人男子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、 $AUC_{0 \rightarrow 24}$ 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 | |
|-------------------------|------------------------------------|-------------------|---------------|-----------------|
| | $AUC_{0 \rightarrow 24}$ (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 |
| 標準製剤（錠剤、60mg） | 1718 ± 773 | 279.5 ± 138.1 | 1.9 ± 0.9 | 4.62 ± 0.93 |

(Mean \pm S. D., 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」⁷⁾

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」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照

(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

該当資料なし

(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

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

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

本剤は血液透析によって除去できない。（「Ⅷ. 13. 過量投与」の項参照）

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）

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) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

| 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。 |

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

「VIII. 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）」、「VIII. 8. (2) 重大な副作用と初期症状」、「VIII. 8. (3) その他の副作用」の項参照。

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。

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

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）

15. その他の注意

該当しない

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

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 「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. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造後 3 年（外装に表示の使用期限内に使用すること）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱いについて

該当しない

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

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）

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 「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、バラ）、

140 錠（PTP14 錠×10）、500 錠（PTP10 錠×50）、

700 錠（PTP14 錠×50）

7. 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

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

不明

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

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」：2013年2月15日

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」：2013年2月15日

承認番号

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」：22500AMX00192000

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」：22500AMX00191000

11. 薬価基準収載年月日

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」：2013年6月21日

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」：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. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

| 販売名 | HOT 番号 | 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「三和」 | 122512901 | 4490023F2179 | 622251201 |
| フェキソフェナジン 塩酸塩錠 60mg「三和」 | 122513601 | 4490023F1172 | 622251301 |

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) 第十六改正日本薬局方解説書 (廣川書店) : C-3867, 2011
- 2) (株) 三和化学研究所 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) (株) 三和化学研究所 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) (株) 三和化学研究所 社内資料 (フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg 「三和」 溶出試験)
- 5) (株) 三和化学研究所 社内資料 (フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg 「三和」 溶出試験)
- 6) (株) 三和化学研究所 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)
- 7) (株) 三和化学研究所 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)
- 8) Gerald GB, et al: Drugs in Pregnancy and Lactation 8th ed., 718, Lippincott Williams & Wilkins, 2008
- 9) American Academy of Pediatrics : Pediatrics 108 : 776, 2001

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）⁸⁾

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」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。

<使用上の注意> 「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。〕

| | 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 (2013年4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（米国小児科学会(AAP)の分類基準)⁹⁾

本邦における使用上の注意「妊婦，産婦，授乳婦等への投与」の項の記載は前述のとおりであり、米国小児科学会(AAP)の分類基準とは異なる。

<米国小児科学会(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

その他の関連資料

該当資料なし