2024年5月改訂（第7版）

日本標準商品分類番号：87449

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「ZE」
フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「ZE」

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE TABLETS

剤形	フィルムコーティング錠			
製剤の規制区分	—			
規格・含量	フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「ZE」： 1錠中 日局 フェキソフェナジン塩酸塩 30mg含有 フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「ZE」： 1錠中 日局 フェキソフェナジン塩酸塩 60mg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）			
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	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
	錠30mg	2013年2月15日	2013年6月21日	2013年6月21日
	錠60mg	2013年2月15日	2013年6月21日	2013年6月21日
製造販売（輸入）・提携・販売会社名	発　売　元：全星薬品株式会社 製造販売元：全星薬品工業株式会社			
医薬情報担当者の連絡先				
問い合わせ窓口	全星薬品工業株式会社　医薬情報部 0120-189-228 TEL 06-6630-8820 FAX 06-6630-8990 受付時間：9:00～17:00（土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://zensei-med.jp/			

本IFは2024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。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 －日本病院薬剤師会－

（2020 年 4 月改訂）

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、ＩＦ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ＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ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ＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領 2008 以降、ＩＦ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ＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦ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（http://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ＩＦ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・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、ＩＦ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．ＩＦとは

ＩＦ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。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ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、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。

ＩＦ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．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦ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ＩＦを作成・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利用者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、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、ＩＦ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

ＩＦ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。ＩＦ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・表現には薬機法の広告規則や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、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ＩＦ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、ＩＦを活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。

目　次

Ⅰ. 概要に関する項目 …… 1
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 …… 2
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 …… 3
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 …… 4
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 …… 6
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 7
9. 溶出性 …… 7
10. 容器・包装 …… 11
11. 別途提供される資材類 …… 11
12. その他 …… 11

Ⅴ. 治療に関する項目 …… 12
1. 効能又は効果 …… 12
2. 効能又は効果に関連する注意 …… 12
3. 用法及び用量 …… 12
4. 用法及び用量に関連する注意 …… 12
5. 臨床成績 …… 12

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 …… 16
1. 薬理学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 …… 17
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 …… 19
4. 吸収 …… 19
5. 分布 …… 19
6. 代謝 …… 20
7. 排泄 …… 20
8. トランスポーターに関する情報 …… 20
9. 透析等による除去率 …… 20
10. 特定の背景を有する患者 …… 20
11. その他 …… 21

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 …… 22
1. 警告内容とその理由 …… 22
2. 禁忌内容とその理由 …… 22
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 …… 22
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 …… 22
5. 重要な基本的注意とその理由 …… 22
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 …… 22
7. 相互作用 …… 23
8. 副作用 …… 23
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 …… 24
10. 過量投与 …… 24
11. 適用上の注意 …… 24
12. その他の注意 …… 24

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目 …… 25
1. 薬理試験 …… 25
2. 毒性試験 …… 25

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 …… 26
1. 規制区分 …… 26
2. 有効期間 …… 26
3. 包装状態での貯法 …… 26
4. 取扱い上の注意 …… 26
5. 患者向け資材 …… 26
6. 同一成分・同効薬 …… 26
7. 国際誕生年月日 …… 26
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 …… 26
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 …… 26
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 …… 26
11. 再審査期間 …… 26
12. 投薬期間制限に関する情報 …… 26
13. 各種コード …… 27
14. 保険給付上の注意 …… 27

XI. 文献 …… 28
1. 引用文献 …… 28
2. その他の参考文献 …… 29

XII. 参考資料 …… 30
1. 主な外国での発売状況 …… 30
2. 海外における臨床支援情報 …… 30

XIII. 備考 …… 33
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 …… 33
2. その他の関連資料 …… 34

略 語 表

略語	略語内容
Al-P	Alkaline phosphatase アルカリホスファターゼ
ALT	Alanine aminotransferase アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	Aspartate aminotransferase アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
$AUC_{0-\infty}$	Area under the concentration-time curve from zero to ∞ 投与 0 時から無限時間までの濃度-時間曲線下面積
$AUC_{(0\rightarrow24)}$	Area under the concentration-time curve from zero to 24 hr 投与 0 時から 24 時間までの濃度-時間曲線下面積
AUC_{0-30}	Area under the concentration-time curve from zero to 30 hr 投与 0 時から 30 時間までの濃度-時間曲線下面積
CL/F	Apparent total body clearance 見かけの全身クリランス
C_{max}	Maximum blood concentration 最高血中濃度
CYP	Cytochrome P450 シトクロム P450
GM-CSF	Granulocyte macrophage colony stimulating factor 顆粒球マクロファージコロニー刺激因子
γ-GTP	γ-Glutamyl transpeptidase ガンマ-グルタミルトランスペプチダーゼ
IgE	Immunoglobulin E 免疫グロブリン E
IL-8	Interleukin-8 インターロイキン-8
LDH	Lactate dehydrogenase 乳酸脱水素酵素
PTP	Press through package
RMP	Risk management plan 医薬品リスク管理計画
S.D.	Standard deviation 標準偏差
sICAM-1	Soluble intercellular adhesion molecule-1 可溶性細胞間接着分子-1
$t_{1/2}$	Elimination half-life 消失半減期
T_{max}	Time to maximum concentration 最高血中濃度到達時間

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、抗アレルギー剤であり、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）に伴うそう痒の治療に供されている。本邦においては、2000 年 11 月に普通錠が、2011 年 7 月に口腔内崩壊錠が上市されている。
フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」・同錠 60mg「ZE」は全星薬品工業が後発医薬品として、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）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 月に承認を取得、同年 6 月に上市した。
なお、本剤は後発医薬品として、全星薬品工業株式会社、ニプロ株式会社の 2 社で共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得て上市に至った。

2. 製品の治療学的特性

(1) フェキソフェナジン塩酸塩を有効成分とするアレルギー性疾患治療薬である。
(2) 非鎮痛性の第二世代抗ヒスタミン薬に分類されている。
(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、好中球減少が報告されている。（「Ⅷ.8.副作用」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

錠剤の形状は飲みやすさを考慮した円形であり、裏面には含量を刻印している。

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「ZE」
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」

(2) 洋名

FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE TABLETS 30mg「ZE」
FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE TABLETS 60mg「ZE」

(3) 名称の由来

医薬発第 935 号(平成 12 年 9 月 19 日)に従う「一般名＋剤形＋含量＋屋号」販売名である

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

フェキソフェナジン塩酸塩（JAN）

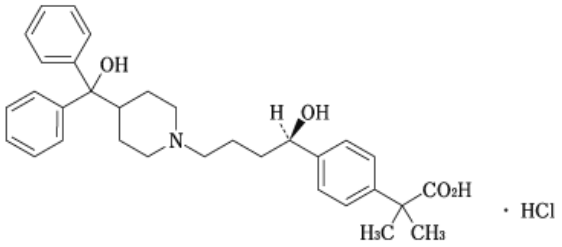
(2) 洋名（命名法）

Fexofenadine Hydrochloride（JAN）

(3) ステム

不明

3. 構造式又は示性式



及び鏡像異性体

4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{32}H_{39}NO_4$・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

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

フェキソフェナジン塩酸塩は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。結晶多形が認められる。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

199.3℃（自動融点測定装置）[1)]

(5) 酸塩基解離定数

p*K*a＝4.25 及び 9.53（カルボキシル基及びピペリジノ基の p*K*a をフェキソフェナジンの塩酸又は水酸化ナトリウム液（25℃）中での溶解度から算出）[1)]

(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

日局「フェキソフェナジン塩酸塩」の確認試験

(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

日局「フェキソフェナジン塩酸塩」の定量法

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

錠剤：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「ZE」	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」
性状	色調	うすいだいだい色	
	剤形	フィルムコーティング錠	
外形			
規格	錠径（mm）	6.6	8.6
	厚み（mm）	3.4	4.2
	重量（mg）	104	206
識別コード		ZE76、30	ZE77、60

(3) 識別コード

	販売名		フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」
	本体		ZE76、30	ZE77、60
包材（PTP）	表	色調	無色透明／銀色	無色透明／銀色
		耳	フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」
		シート	ZE76／30mg	ZE77／60mg
	裏	色調	白色	白色
		耳	FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE 30mg「ZE」	FEXOFENADINE HYDROCHLORIDE 60mg「ZE」
		シート	フェキソフェナジン塩酸塩錠「ZE」／30mg／プラマーク／取り出しケアマーク／GS1 コード	フェキソフェナジン塩酸塩錠「ZE」／60mg／プラマーク／取り出しケアマーク／GS1 コード

(4) 製剤の物性

硬度

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」：平均値 3.0kg 以上（PV 実施計画書）

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」：平均値 3.0kg 以上（PV 実施計画書）

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」
成分・分量（1 錠中）	日局 フェキソフェナジン塩酸塩 30mg	日局 フェキソフェナジン塩酸塩 60mg
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、ヒドロキシプロピルセルロース、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 6000、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ	

(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

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」[2)]

包装形態：PTP 包装（ポリ塩化ビニルフィルム及びアルミニウム箔）したもの

試験条件：40±1℃/75±5%RH

試験項目	開始時	1 箇月	3 箇月	6 箇月
性状（うすいだいだい色のフィルムコーティング錠である）	規格内	規格内	規格内	規格内
確認試験（紫外可視吸光度測定法）	適合	適合	適合	適合
製剤均一性（含量均一性試験）	規格内	－	－	－
溶出性（30 分 80%以上）	規格内	－	－	規格内
定量（%）（95.0～105.0）	100.29～100.66	－	－	100.01～100.88

1 ロット n=3　3 ロット

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」[3)]

包装形態：PTP 包装（ポリ塩化ビニルフィルム及びアルミニウム箔）したもの

試験条件：40±1℃/75±5%RH

試験項目	開始時	1 箇月	3 箇月	6 箇月
性状（うすいだいだい色のフィルムコーティング錠である）	規格内	規格内	規格内	規格内
確認試験（紫外可視吸光度測定法）	適合	適合	適合	適合
製剤均一性（含量均一性試験）	規格内	－	－	－
溶出性（30 分 80%以上）	規格内	－	－	規格内
定量（%）（95.0～105.0）	100.88～101.40	－	－	101.31～101.65

1 ロット n=3　3 ロット

包装形態：バラ包装（ポリエチレン瓶に入れ、密栓したもの）

試験条件：40±1℃/75±5%RH

試験項目	開始時	1 箇月	3 箇月	6 箇月
性状（うすいだいだい色のフィルムコーティング錠である）	規格内	規格内	規格内	規格内
確認試験（紫外可視吸光度測定法）	適合	適合	適合	適合
製剤均一性（含量均一性試験）	規格内	－	－	－
溶出性（30 分 80%以上）	規格内	－	－	規格内
定量（%）（95.0～105.0）	100.88～101.40	－	－	101.49～101.87

1 ロット n=3　3 ロット

(2) 無包装安定性試験

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」[4)]

保存条件		試験項目	開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
温度	40±2℃ 褐色 ガラス瓶 （密栓）	性状（うすいだいだい色のフィルムコーティング錠）	規格内	規格内	規格内	規格内
		類縁物質（%）	0.10	0.11	0.11	0.11
		溶出性（30 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内	規格内
		定量（%）（95.0～105.0）	99.33	98.99	99.73	98.89
		硬度*1（kg 重）（3.0kg 重以上）	14.71	14.38	14.38	14.57
湿度	25±2℃ 75±5%RH 褐色 ガラス瓶 （開栓）	性状（うすいだいだい色のフィルムコーティング錠）	規格内	規格内	規格内	規格内
		類縁物質（%）	0.10	0.11	0.11	0.11
		溶出性（30 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内	規格内
		定量（%）（95.0～105.0）	99.33	99.18	99.39	99.13
		硬度*（kg 重）（3.0kg 重以上）	14.71	10.61	10.36	10.34

保存条件		試験項目	開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
光	2000lx 無色 ガラス瓶 （密栓）	性状（うすいだいだい色のフィルムコーティング錠）	規格内	規格内	規格内
		類縁物質（%）	0.10	0.12	0.14
		溶出性（30 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内
		定量（%）（95.0～105.0）	99.33	100.06	99.16
		硬度*（kg 重）（3.0kg 重以上）	14.71	14.28	13.97

＊：参考値

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」[5)]

保存条件		試験項目	開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
温度	40±2℃ 褐色 ガラス瓶 （密栓）	性状（うすいだいだい色のフィルムコーティング錠）	規格内	規格内	規格内	規格内
		類縁物質（%）	0.11	0.12	0.11	0.12
		溶出性（30 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内	規格内
		定量（%）（95.0～105.0）	98.85	99.11	98.79	98.03
		硬度*（kg 重）（3.0kg 重以上）	16.28	16.46	15.75	16.36
湿度	25±2℃ 75±5%RH 褐色 ガラス瓶 （開栓）	性状（うすいだいだい色のフィルムコーティング錠）	規格内	規格内	規格内	規格内
		類縁物質（%）	0.11	0.11	0.11	0.11
		溶出性（30 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内	規格内
		定量（%）（95.0～105.0）	98.85	99.14	99.13	98.16
		硬度*（kg 重）（3.0kg 重以上）	16.28	12.83	13.10	12.00

保存条件		試験項目	開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
光	2000lx 無色 ガラス瓶 （密栓）	性状（うすいだいだい色のフィルムコーティング錠）	規格内	規格内	規格内
		類縁物質（%）	0.11	0.13	0.14
		溶出性（30 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内
		定量（%）（95.0～105.0）	98.85	99.44	99.29
		硬度*（kg 重）（3.0kg 重以上）	16.28	16.61	16.13

＊：参考値

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（物理化学的変化）

該当しない

9. 溶出性

(1) 日本薬局方医薬品各条の規格に対する適合性

溶出試験法

日本薬局方一般試験法・溶出試験 パドル法

試験条件：回 転 数：50rpm
試 験 液：水
試験液量：900mL

測 定 法：液体クロマトグラフィー（測定波長：220nm）

結果：本剤は以下の規格に適合した[6),7)]。

販売名	規定時間	溶出率
フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」	30 分	80%以上
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」		

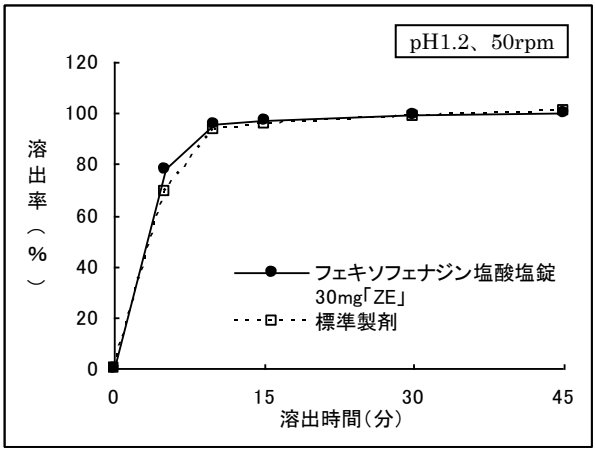
(2) 溶出挙動における同等性

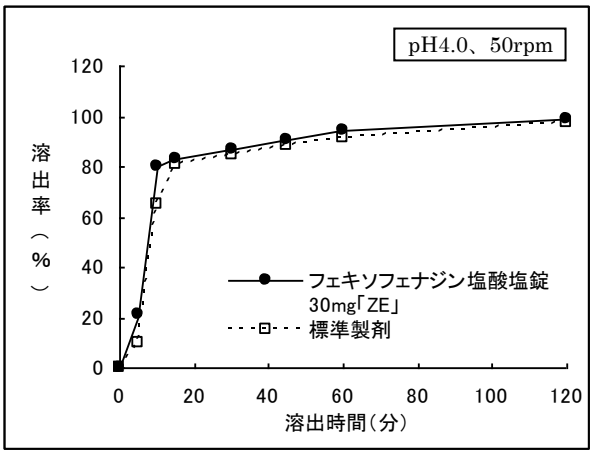
「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 18 年 11 月 24 日付薬食審査発第 1124004 号）に従い、製剤比較試験を行った。

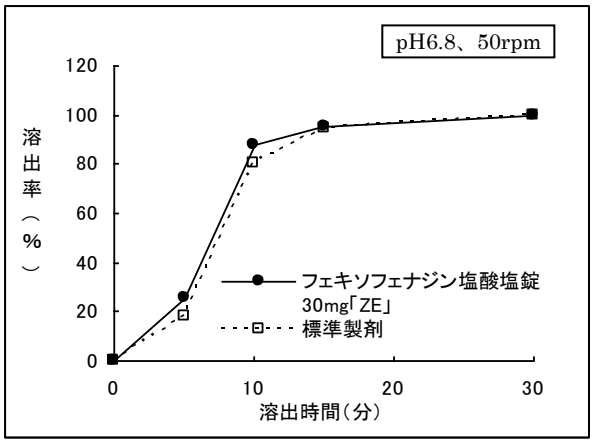
フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」[6)]

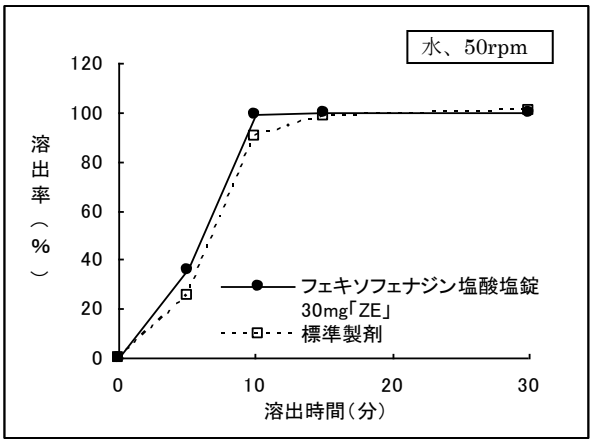
<table>
<tr><td colspan="2">試験製剤</td><td>フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」</td></tr>
<tr><td colspan="2">標準製剤</td><td>フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」</td></tr>
<tr><td colspan="2">処方変更基準</td><td>B 水準</td></tr>
<tr><td rowspan="8">試験方法</td><td>装置</td><td>日本薬局方一般試験法・溶出試験 パドル法</td></tr>
<tr><td>試験液量</td><td>900mL</td></tr>
<tr><td>温度</td><td>37±0.5℃</td></tr>
<tr><td>回転数</td><td>50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）、100rpm（pH4.0）</td></tr>
<tr><td rowspan="4">試験液</td><td>pH1.2:日本薬局方の溶出試験第 1 液</td></tr>
<tr><td>pH4.0:0.05mol/L リン酸水素二ナトリウムと 0.025mol/L クエン酸を用いて pH4.0 に調整したもの</td></tr>
<tr><td>pH6.8:日本薬局方の溶出試験第 2 液</td></tr>
<tr><td>水</td></tr>
<tr><td>界面活性剤添加</td><td>なし</td></tr>
<tr><td colspan="2">標準製剤の平均溶出率が 85%を超えた時点で終了とする。</td></tr>
<tr><td colspan="2">判定基準</td><td>●pH1.2・pH6.8・水（50rpm）・pH4.0（100rpm）
標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合で、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。
●pH4.0（50rpm）
標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合で、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%以上となるとき、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。</td></tr>
</table>

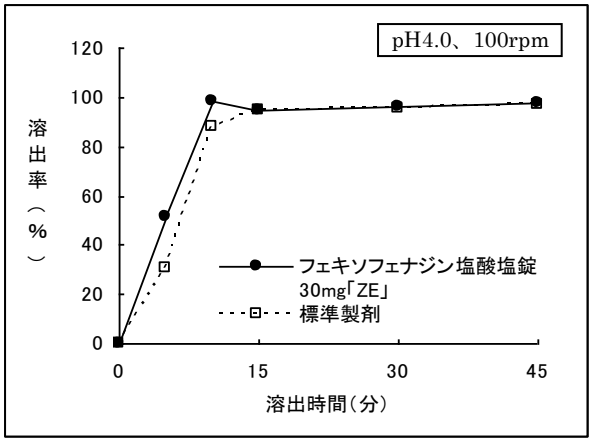
	（個々の溶出率） ●pH1.2・pH6.8・水（50rpm）・pH4.0（100rpm） 標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。 ●pH4.0（50rpm） 標準製剤の平均溶出率が 50%以上に達し 85%に達しないとき、試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±20%の範囲を超えるものがない。











溶出挙動における同等性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件				標準製剤（錠剤、60mg）	フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」	f2 関数	判定
試験方法	回転数	試験液	溶出時間	平均溶出率（%）	平均溶出率（%）		
パドル法	50rpm	pH1.2	15 分	95.74	97.00	－	適合
		pH4.0	10 分	65.18	79.71	58.4	適合
			30 分	84.88	86.91		
		pH6.8	15 分	94.40	95.58	－	適合
		水	15 分	98.48	99.92	－	適合
	100rpm	pH4.0	15 分	94.68	94.46	－	適合

(n=12)

溶出挙動の同等性の判定結果（個々の溶出率）

試験条件		平均溶出率の±12%又は±15%の範囲を超えるもの*	判定
50rpm	pH1.2	0 個	適合
	pH4.0	0 個	適合
	pH6.8	0 個	適合
	水	0 個	適合
100rpm	pH4.0	0 個	適合

＊各判定基準については、同等性判定基準の個々の溶出率の項を参照。 (n=12)

＜結果＞

試験製剤と標準製剤の溶出挙動を比較したところ、すべての条件において溶出挙動の判定基準に適合した。以上より、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等とみなされた。

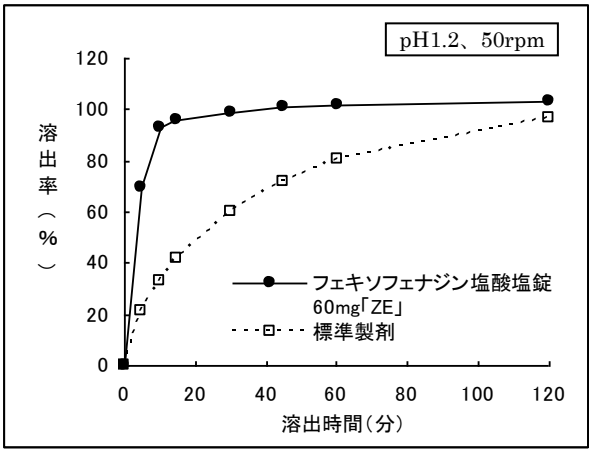
(3) 溶出挙動における類似性

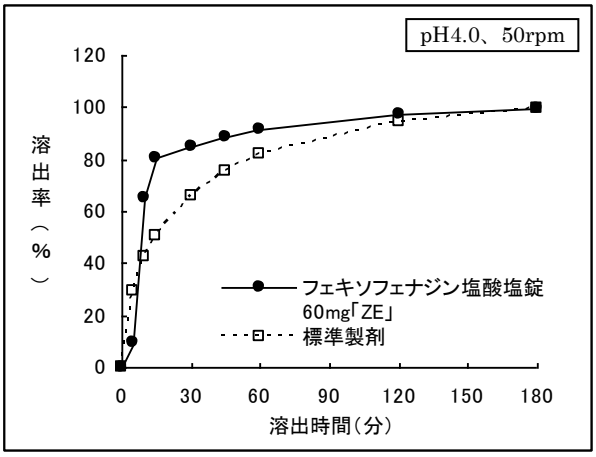
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成 18 年 11 月 24 日付薬食審査発第 1124004 号）に従い、製剤比較試験を行った。

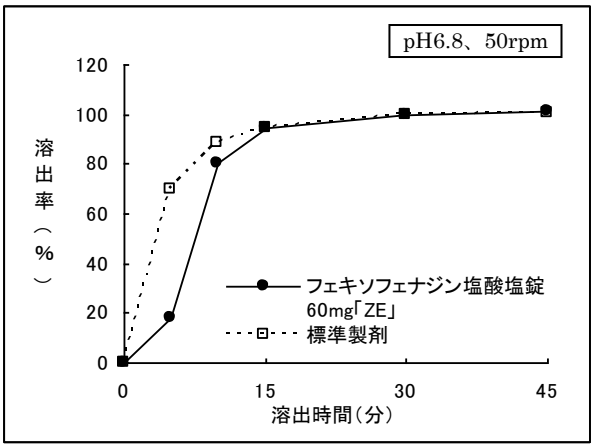
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」[7)]

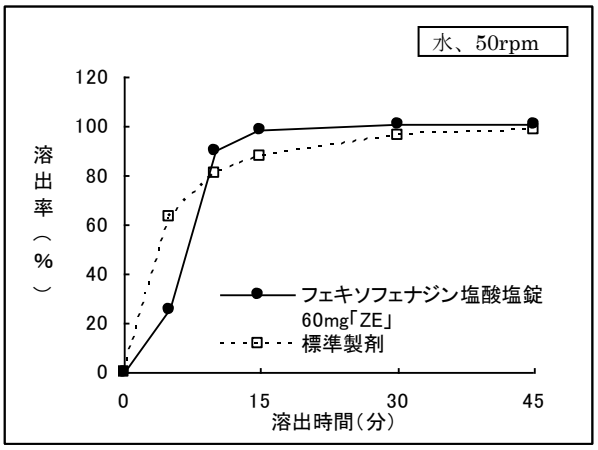
試験製剤		フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」
標準製剤		アレグラ錠 60mg
試験方法	装置	日本薬局方一般試験法・溶出試験 パドル法
	試験液量	900mL
	温度	37±0.5℃
	回転数	50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）、100rpm（pH1.2）
	試験液	pH1.2:日本薬局方の溶出試験第 1 液
		pH4.0:0.05mol/L リン酸水素二ナトリウムと 0.025mol/L クエン酸を用いて pH4.0 に調整したもの
		pH6.8:日本薬局方の溶出試験第 2 液
		水
	界面活性剤添加	なし
	標準製剤の平均溶出率が 85%を超えた時点で終了とする。	

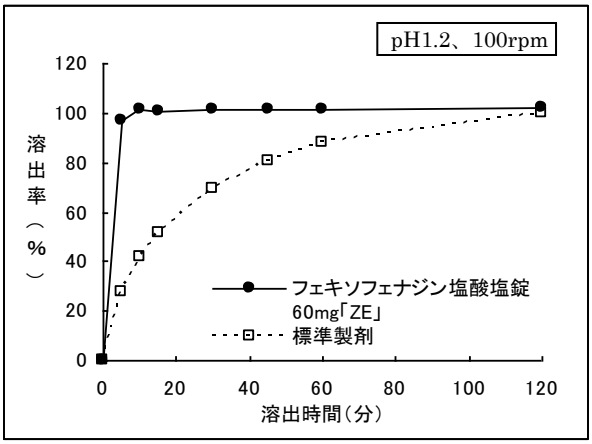
判定基準	●pH6.8・水（50prm） 標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合で、試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。 ●pH1.2（50・100rpm）・pH4.0（50rpm） 標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合で、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となるとき、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値は 42 以上である。











溶出挙動における類似性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件				標準製剤（錠剤、60mg）	フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」	f2 関数	判定
試験方法	回転数	試験液	溶出時間	平均溶出率（%）	平均溶出率（%）		
パドル法	50rpm	pH1.2	15 分	41.66	95.74	21.1	不適合
			60 分	80.18	101.56		
		pH4.0	10 分	42.25	65.18	35.2	不適合
			60 分	81.62	91.12		
		pH6.8	15 分	94.87	94.40	－	適合
		水	15 分	87.68	98.48	－	適合
	100rpm	pH1.2	10 分	41.55	101.13	24.9	不適合
			60 分	88.20	101.52		

(n=12)

＜結果＞

試験液 pH6.8 及び水では標準製剤と溶出挙動の類似性が認められ、試験液 pH1.2（50・100rpm）及び pH4.0 では類似性は認められなかった。なお、健康成人男子を対象とした生物学的同等性試験では、両製剤は生物学的に同等であ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「ZE」〉

100 錠［10 錠（PTP）×10］

〈フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」〉

100 錠［10 錠（PTP）×10］

500 錠［10 錠（PTP）×50］

500 錠［容器、バラ］

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

包装	容器	材質
PTP 包装	PTP	ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔
バラ包装	ボトル	ポリエチレン
	キャップ	ポリプロピレン

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Ⅲ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[注1)]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[8),9)]。

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Ⅲ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[10),11)]。

〈アレルギー性鼻炎〉

③国内第Ⅲ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[12)]。

④海外第Ⅲ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[13),14)]。

⑤国内第Ⅲ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 30mg1 日 2 回、12～15 歳は 1 回 60mg1 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 1g1 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）注 2)
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[15)]。

〈アトピー性皮膚炎〉

⑥国内第Ⅲ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[16)]。

⑦国内第Ⅲ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）注 3)
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[17),18)]。

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

該当資料なし

(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 注 1)、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[19)]。

② 健康成人にフェキソフェナジン塩酸塩 120mg 注 1)、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_1 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[20)]。

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[21]（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[注1)]まで1日2回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[22),23)]（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60mg1日2回6ヵ月、1回400mg[注1)]1日2回1週間及び240mg1日1回[注1)]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[24)-26)]（外国人データ）。

③ 健康成人男子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120mg1日2回7日間、エリスロマイシン1回300mg1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[27)]。

④ C_{max}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[25),28)]（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^+チャネルに対する影響は認められていない[29)]。

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[30]。

(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}～3×10^{-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。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型カルシウムチャネルに対する親和性は認められていない[31]。

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[32]。

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[33]。

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[34]。

(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

健康成人男子8例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル60mg[注1)]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[35)]。

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[36)]。

血漿中濃度パラメータ

投与量	$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)	T_{max} (hr)	C_{max} (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	CL/F (L/hr)
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の血漿中濃度パラメータは以下のとおりであった[37)]。

血漿中濃度パラメータ

対象患者	年齢(歳)	投与量	症例数	$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	CL/F (L/hr)
日本人小児患者[注2)]	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[注3)] (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

〈フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「ZE」〉

フェキソフェナジン塩酸塩錠30mg「ZE」は、「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「ZE」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[38)]。

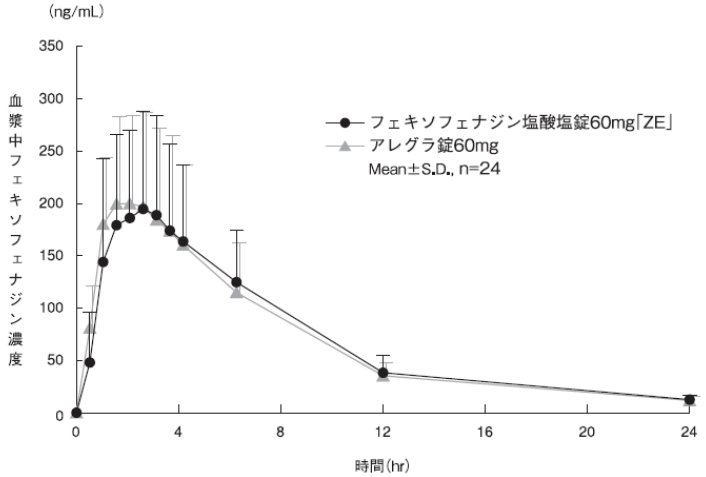
〈フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「ZE」〉

フェキソフェナジン塩酸塩錠60mg「ZE」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）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、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、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[39)]。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC $_{(0\to24)}$ (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」	1681.0±642.8	234.4±95.4	2.4±1.4	5.5±0.8
アレグラ錠 60mg	1656.8±617.7	225.7±93.3	2.1±1.2	5.5±0.8

(Mean±S.D., n=24)



血漿中フェキソフェナジン濃度推移

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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 併用薬の影響

①エリスロマイシン

健康成人男子 18 例にフェキソフェナジン塩酸塩円形錠[注 4)] 1 回 120mg1 日 2 回[注 5)] 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[27),40)]。

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[41)]。

注 4) 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[42)]。

②水酸化アルミニウム・水酸化マグネシウム含有製剤

健康成人男子 22 例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル 120mg[注 5)] 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[43)]（外国人データ）。

③ケトコナゾール

健康成人男子 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[注 5)] 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[44)]（外国人データ）。

④オメプラゾール

健康成人男子 23 例にフェキソフェナジン塩酸塩カプセル 120mg [注5)] 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 [43)]（外国人データ）。

注 5）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）その他併用薬の影響

「Ⅷ.7.相互作用」の項参照

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

健康成人男子 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 [注5)] 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 [45)]（外国人データ）。

注 5）成人における本剤の承認用量は 1 回 60mg、1 日 2 回である。

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

「Ⅷ.6.（6）授乳婦」の項参照

(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 [注5)] 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 [46)]。

注 5）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
健康成人男子 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 [47)]。
健康成人男子に ^{14}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 [48)]（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
該当資料なし

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 [注5)] 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 [49),50)]（外国人データ）。

注 5）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）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 [注5)] 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・hr/mL、C_{max} は 281ng/mL、$t_{1/2}$ は 16.0hr 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 1.2、1.1、1.2 倍であった。なお、忍容性は良好であった [51),52)]（外

国人データ)。

注5) 成人における本剤の承認用量は1回60mg、1日2回である。

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[注5)]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・hr/mL、C_{max}は418ng/mL、$t_{1/2}$は15.2hr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[53),54)] (外国人データ)。

注5) 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、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。

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	悪夢、睡眠障害、しび	

	怠感、めまい、不眠、神経過敏	れ感	

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
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。

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：―
有効成分：―

2. 有効期間

有効期間：3 年

3. 包装状態での貯法

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：なし
くすりのしおり：あり
その他の患者向け資材：なし

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：アレグラ錠 30mg・60mg（サノフィ）
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

7. 国際誕生年月日

1996 年 3 月 11 日

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「ZE」	2013 年 2 月 15 日	22500AMX00058000	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「ZE」	2013 年 2 月 15 日	22500AMX00059000	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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

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。

13. 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「ZE」	4490023F2136	4490023F2136	121843501	622184301
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」	4490023F1130	4490023F1130	121844201	622184401

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

1) 日本薬剤師研修センター編: 第十八改正 日本薬局方 医薬品情報 JPDI2021. じほう社: 2021: 605-607
2) 社内資料: 加速試験（錠 30mg）
3) 社内資料: 加速試験（錠 60mg）
4) 社内資料: 無包装状態における安定性試験（錠 30mg）
5) 社内資料: 無包装状態における安定性試験（錠 60mg）
6) 社内資料: 溶出試験（30mg）
7) 社内資料: 溶出試験（60mg）
8) Kawashima M, et al.: Int Arch Allergy Immunol. 2001; 124 (1-3) : 343-345
9) 蕁麻疹患者における国内第Ⅲ相試験（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 AF, et al.: J Allergy Clin Immunol. 1999; 104 (5) : 1071-1078 (PMID: 10550755)
11) 蕁麻疹患者における海外第Ⅲ相試験（アレグラ錠: 2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要ト.Ⅳ.1.(1)）
12) 季節性アレルギー性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 DI, et al.: Ann Allergy Asthma Immunol. 1997; 79 (5) : 443-448 (PMID: 9396979)
14) 季節性アレルギー性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 JM, et al.: Ann Intern Med. 2000; 132: 354-363 (PMID: 10691585)
22) Pratt CM, et al.: Am J Cardiol. 1999; 83: 1451-1454 (PMID: 10335761)
23) アレルギー性鼻炎における用量反応性（アレグラ錠: 2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要ト.Ⅳ.2.(1)）
24) Pratt C, et al.: Clin Exp Allergy. 1999; 29 (Suppl.3) : 212-216 (PMID: 10444240)
25) 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、申請資料概要ト.Ⅰ.5.(4)）
26) 健康成人長期投与試験①（アレグラ錠: 2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要ト.Ⅴ.1. (1)、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、申請資料概要ヘ.Ⅲ.2.(1)、ト.Ⅰ.5. (1)）
28) 健康成人長期投与試験②（アレグラ錠: 2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要ヘ.Ⅲ.3. (1)）
29) 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)）
30) 薬理作用（アレグラ錠: 2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要ホ.Ⅰ）
31) 薬効薬理の検討①（アレグラ錠: 2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要ホ.Ⅰ.2. (1)、ホ.Ⅰ.2.(4)）
32) Abdelaziz MM, et al.: J Allergy Clin Immunol. 1998; 101: 410-420 (PMID: 9525460)
33) 薬効薬理の検討②（アレグラ錠: 2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要ホ.Ⅰ.2. (2)）
34) 薬効薬理の検討③（アレグラ錠: 2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要ホ.Ⅰ.1）
35) 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、申請資料概要ヘ.Ⅲ.1.(1)）

36）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)）
37）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）、2.7.6.(2)）
38）社内資料：生物学的同等性試験（錠 30mg）
39）社内資料：生物学的同等性試験（錠 60mg）
40）浦江明憲 他：臨床薬理．2000；31（5）：639-648
41）薬物相互作用（イヌ）（アレグラ錠：2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要へ.Ⅱ.5.（3））
42）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））
43）オメプラゾール及び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.（3）、へ.Ⅲ.2.（4））
44）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））
45）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））
46）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））
47）健康成人における代謝①（アレグラ錠：2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要へ.Ⅲ.1.（2））
48）健康成人における代謝②（アレグラ錠：2000 年 9 月 22 日承認、申請資料概要へ.Ⅲ.1.（3））
49）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)）
50）腎機能障害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)）
51）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)）
52）肝機能障害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)）
53）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））
54）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)）
55）社内資料：粉砕後の安定性試験（錠 30mg）
56）社内資料：粉砕後の安定性試験（錠 60mg）
57）社内資料：懸濁及びチューブ通過性試験

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

海外での主な販売名は以下のとおりである。(2024年4月時点)

国名	販売名
欧州	Telfast、Allegra

注）上記品目については、ライセンス関係のない企業が販売している。

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（英国SPC、オーストラリア分類）

日本の電子添文の「9.5 妊婦」「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリア分類や英国SPCとは異なる。

9.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。

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。

出典	記載内容
英国SPC（30mg） （2023年3月）	**Fertility, Pregnancy and lactation** *Pregnancy* There are no adequate data from the use of Fexofenadine hydrochloride in pregnant women. Limited animal studies do not indicate direct or indirect harmful effects with respect to effects on pregnancy, embryonal/foetal development, parturition or postnatal development. Fexofenadine hydrochloride should not be used during pregnancy unless clearly necessary. *Breast-feeding* There are no data on the content of human milk after administering Fexofenadine hydrochloride. However, when terfenadine was administered to nursing mothers Fexofenadine was found to cross into human breast milk. Therefore Fexofenadine hydrochloride is not recommended for mothers breast-feeding their babies. *Fertility* No human data on the effect of fexofenadine hydrochloride on fertility are available. In mice, there was no effect on fertility with fexofenadine hydrochloride treatment
英国SPC（120mg） （2023年3月）	**Fertility, Pregnancy and lactation** *Pregnancy* There are no adequate data from the use of fexofenadine hydrochloride in pregnant women. Limited animal studies do not indicate direct or indirect harmful effects with respect to effects on pregnancy,

	embryonal/foetal development, parturition or postnatal development. Fexofenadine hydrochloride should not be used during pregnancy unless clearly necessary. *Breast-feeding* There are no data on the content of human milk after administering fexofenadine hydrochloride. However, when terfenadine was administered to nursing mothers fexofenadine was found to cross into human breast milk. Therefore fexofenadine hydrochloride is not recommended for mothers breast-feeding their babies. *Fertility* No human data on the effect of fexofenadine hydrochloride on fertility are available. In mice, there was no effect on fertility with fexofenadine hydrochloride treatment.

	分類
オーストラリア分類	B2（2024年3月）※

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.

※ Prescribing medicines in pregnancy database (2024／4／19アクセス)
＜https://www.tga.gov.au/products/medicines/find-information-about-medicine/prescribing-medicines-pregnancy-database＞

小児等に関する記載

日本の電子添文の「9.7 小児」の項の記載は以下のとおりであり、英国のSPCとは異なる。

9.特定の背景を有する患者に関する注意
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。

出典	記載内容
英国SPC（30mg） （2023年3月）	**Posology and method of administration** *Children 6 to 11 years of age* The recommended dose of Fexofenadine hydrochloride in children aged 6 to 11 years is 30 mg twice daily. *Children under 6 years of age* The efficacy of Fexofenadine hydrochloride has not been established in children under 6 years of age.

	Special population The safety and efficacy of Fexofenadine hydrochloride in renally or hepatically impaired children have not been established. Studies conducted in adults in special risk groups (renally or hepatically impaired patients) indicate that it is not necessary to adjust the dose of Fexofenadine hydrochloride in adults.
英国SPC（120mg） （2023年3月）	**Posology and method of administration** *Children aged 12 years and over* The recommended does of fexofenadine hydrochloride for children aged 12 years and over is 120mg once daily taken before a meal. *Children under 12 years of age* The efficacy and safety of fexofenadine hydrochloride 120mg has not been studied in children under 12. In children from 6 to 11 years of age : fexofenadine hydrochloride 30 mg tablet is the appropriate formulation for administration and dosing in this population. *Special population* Studies in special risk groups (elderly, renally or hepatically impaired patients) indicate that it is not necessary to adjust the dose of fexofenadine hydrochloride in these patients.

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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

掲載根拠：「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する Q&A について（その 3）」（令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡）

(1) 粉砕

フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」[55)]

保存条件：40±2℃、遮光・密栓

試験項目	開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
外観	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末
定量（%）（95.0～105.0）	98.39	98.52	99.00	99.11

保存条件：25±2℃/75±5%RH、遮光・開栓

試験項目	開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
外観	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末
定量（%）（95.0～105.0）	98.39	98.48	98.71	99.29

保存条件：2000lx、密栓

試験項目	開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
外観	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末
定量（%）（95.0～105.0）	98.39	97.96	99.05

フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」[56)]

保存条件：40±2℃、遮光・密栓

試験項目	開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
外観	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末
定量（%）（95.0～105.0）	99.02	98.65	98.98	98.27

保存条件：25±2℃/75±5%RH、遮光・開栓

試験項目	開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
外観	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末
定量（%）（95.0～105.0）	99.02	99.36	99.24	98.61

保存条件：2000lx、密栓

試験項目	開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
外観	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末	うすいだいだい色のフィルムが混じった白色の粉末
定量（%）（95.0～105.0）	99.02	98.42	98.56

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

本試験は、「内服薬　経管投与ハンドブック（(株) じほう)」に準じて下記手順に従い実施した[57]。

1）試験方法

［崩壊懸濁試験］

・50mL のカテーテル用シリンジに錠剤 1 錠を入れる。
・55℃に温めた水道水を 20mL 吸入する。
・5 分間放置後カテーテル用シリンジを手で 90 度 15 往復横転する。崩壊しない場合は、さらに 5 分間放置後、同様の操作を行う。
・合計 10 分で崩壊懸濁しない場合は、錠剤 1 個を薬包紙に包み、上から乳棒で数回叩いて粉砕後、上記と同様の操作を行う。

［通過性試験］

・得られた懸濁液を 8Fr.チューブの注入端より、約 2～3mL/sec の速度で注入する。

2）試験結果

販売名	崩壊懸濁試験	通過性試験
フェキソフェナジン塩酸塩錠 30mg「ZE」	10 分間放置後、崩壊懸濁した	8Fr.チューブを通過した
フェキソフェナジン塩酸塩錠 60mg「ZE」	10 分間放置後、崩壊懸濁した	8Fr.チューブを通過した

(n=3)

2. その他の関連資料

該当資料なし