

◎アレグラ錠, ○フェキソフェナジン塩酸塩 OD 錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】フェキソフェナジン塩酸塩 (U) Fexofenadine Hydrochloride 【分類】抗アレルギー剤

【単位】◎60mg/錠

【常用量】120mg/日

【用法】1日2回

【透析患者への投与方法】60~120mg/日 (5) Cmax が1.5倍高く, 消失半減期が1.4倍延長するため長期投与時には減量を考慮 (5)

【その他の報告】半減期が延長するため長期投与時には投与間隔を2倍に延長する (12)

60mgを24hr毎 [HD日はHD後] (17) 24hr毎 (3)

ESRDでは主に小腸P-gpの低下によりAUCが2倍に上昇する [半減期延長なし] (Nolin TD, et al: J Am Soc Nephrol. 2009 PMID: 19696225)

1回60mg1日2回投与は透析患者の掻痒症治療に有効であり安全に適用できる (斎藤 修, 他: 透析会誌 42: 507-14, 2009)

【PD】60mgを24hr毎 (17)

【CRRT】60mgを12hr毎 (17)

【保存期CKD患者への投与方法】GFR>50mL/min: 減量の必要なし, GFR10~50mL/min: 半減期が延長するため投与間隔を1~2倍に延長, GFR<10mL/min: 半減期が延長するため投与間隔を2倍に延長 (12)

【その他の報告】GFR>50mL/min: 12hr毎, GFR10~50mL/min: 12~24hr毎, GFR<10mL/min: 24hr毎 (3,17)

【特徴】テルフェナジンの代謝物。末梢H1受容体を選択的に阻害する。QTc間隔の延長は認められない。

【主な副作用・毒性】頭痛, 眠気, 嘔気, ショック・アナフィラキシー, 肝機能障害, 血球減少など

【吸収】速やかに吸収される (U) 食後投与でAUCが軽度低下 (1)

【F】35% (Lappin G, et al: Eur J Pharm Sci 40: 125-131, 2010)

【tmax】2.2hr (1) 2.6hr (U)

【Cmax】健康人に対して、60mg水剤単回投与で209μg/mL、60mg錠剤単回投与で142μg/mL、12時間ごとに60mg錠剤投与で286μg/mL (U)

【代謝】ほとんど代謝されない (1) 5%が代謝を受け、0.5~1.5%がCYP3A4で代謝 (U) 3.5%が腸内細菌によるメチルエステルに代謝 (U) MDR1遺伝子の一部の変異が抗アレルギー作用の相違に関連 (Alzoubi KH, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 51: 880-7, 2013)

【排泄】尿中未変化体排泄率11%, 糞中80% [po, 48hrまで] (1,U) 3~5% (12) P-gpの基質になる (1)

【CL/F】44.4L/hr (1) 【腎CL】3~4L/hr (1,U)

【t1/2】7.7~13.8hr (1) 健康人14.4hr (U) 14hr (12) Ccr 41~80mL/min: 1.6倍に延長, Ccr 11~40mL/min: 1.7倍に延長 (U) 透析患者Cmaxは健康成人に比し、1.5倍高く、平均消失半減期は1.4倍長かったが、忍容性は良好 (1) 【腎不全患者のt1/2】1.3倍に延長 (U) 19~25hr (12)

【蛋白結合率】69.3% (1) 60~82% (1) 60~70% [Alb, AAG] (U,12)

【Vd】5.4~5.8L/kg (U) ほとんど脳に移行しない (1,U) 8~10L/kg (12)

【MW】538.12

【透析性】除去されない [除去率1.7%] (U) (1) 【透析CL】20mL/min [テルフェナジン投与時のデータ] (1)

【O/W係数】2.0 [1-オクタノール水系, pH7.0] (1)

【相互作用】水酸化AL, Mg含有剤との同時服用時, 吸着による吸収率低下 [約40%に低下] (U) 制酸剤との併用によるキレート形成はpHが高い条件でのみ注意 (1) ケトコナゾール, エリスロマイシン: P-gp阻害によるフェキソフェナジンのCL低下と吸収率上昇 (1) フルーツジュースが小腸OATPを阻害してフェキソフェナジンの吸収を低下させる (Dresser GK, et al: Clin Pharmacol Ther 71: 11-20, 2002) GFJによる小腸OATP1A2阻害により, 吸収率が低下する (Dresser GK, et al: Clin Pharmacol Ther 77:170, 2005) ベラパミル: 小腸P-gp阻害によりAUCが2.5倍に上昇, プロベネシド: 腎クリアランスが30%に低下するためAUCが1.5倍に上昇 (Yasui-Furukori N, et al: Clin Pharmacol Ther 77: 17, 2004) リファンピシン併用によりCmaxが30~50%低下し, 経口クリアランスが1.2~1.8倍になる (Hamman MA, et al: Clin Pharmacol Ther 69:114-21,2001) 透析患者においてジゴキシンの血中濃度を低下させる可能性がある (西田愛子, 他: 医療薬学 34: 252-5, 2008) ベラパミルがOATPを介する肝への取り込みがP-gpによる肝分泌を阻害してFを増大させる (Tannergren C, et al: Clin Pharmacol Ther 74: 423-36, 2003)

【小児における情報】年齢より体表面積に影響されると思われる (熊谷雄治, 他: TDM研究 27: 25-32, 2010)

【効果発現までの時間】服用後1hr (U)

【効果持続時間】12hr (U) 使用後28日間は毒性の発現がないことが確認されている (U)

【備考】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 (1)

【更新日】20240530