

2018年6月作成（第1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 2013 に準拠して作成

選択的ヒスタミンH<sub>1</sub>受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤  
日本薬局方 ベポタスチンベシル酸塩錠  
ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「DK」  
ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「DK」  
Bepotastine Besilate

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	ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」 1錠中 ベポタスチンベシル酸塩…5mg ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」 1錠中 ベポタスチンベシル酸塩…10mg
一般名	和名：ベポタスチンベシル酸塩（JAN） 洋名：Bepotastine Besilate（JAN）
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：2012年8月15日 薬価基準収載年月日：2018年6月15日 発売年月日：2018年6月18日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：江州製薬株式会社 製造販売元：大興製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	大興製薬株式会社 安全管理部 TEL：049-266-6061 FAX：049-266-6078 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.daikosyk.co.jp/product/index.html">http://www.daikosyk.co.jp/product/index.html</a>

本 IF は 2018 年 6 月作成の添付文書の記載に基づき作成した。  
最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

# IF 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、IF と略す）の位置付け並びに IF 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 IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、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 IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独) 医薬品医療機器総合機構のホームページ (<http://www.pmda.go.jp/>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品医療機器総合機構ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 2. IF とは

IF 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 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、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。

### 【IF の様式】

- ①規格は A4 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。
- ②IF 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「IF 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。

#### [IF の作成]

- ①IF 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。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF 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 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」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 2013」は、平成 25 年 10 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 2013」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 2013」においては、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ある。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の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総合機構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、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。

(2013 年 4 月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	14
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	14
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	14
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	14
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	14
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	14
5. 化学名（命名法）	2	8. 副作用	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	15
7. CAS 登録番号	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	15
III. 有効成分に関する項目	3	11. 小児等への投与	15
1. 物理化学的性質	3	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	13. 過量投与	15
3. 有効成分の確認試験法	3	14. 適用上の注意	16
4. 有効成分の定量法	3	15. その他の注意	16
IV. 製剤に関する項目	4	16. その他	16
1. 剤形	4	IX. 非臨床試験に関する項目	17
2. 製剤の組成	4	1. 薬理試験	17
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	2. 毒性試験	17
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	18
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	1. 規制区分	18
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	2. 有効期間又は使用期限	18
7. 溶出性	5	3. 貯法・保存条件	18
8. 生物学的試験法	8	4. 薬剤取扱い上の注意点	18
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8	5. 承認条件等	18
10. 製剤中の有効成分の定量法	8	6. 包装	18
11. 力価	8	7. 容器の材質	18
12. 混入する可能性のある夾雑物	8	8. 同一成分・同効薬	18
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8	9. 国際誕生年月日	18
14. その他	8	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
V. 治療に関する項目	9	11. 薬価基準収載年月日	19
1. 効能又は効果	9	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	19
2. 用法及び用量	9	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	19
3. 臨床成績	9	14. 再審査期間	19
VI. 薬効薬理に関する項目	10	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	19
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10	16. 各種コード	19
2. 薬理作用	10	17. 保険給付上の注意	19
VII. 薬物動態に関する項目	11	X I. 文献	20
1. 血中濃度の推移・測定法	11	1. 引用文献	20
2. 薬物速度論的パラメータ	12	2. その他の参考文献	20
3. 吸収	12	X II. 参考資料	21
4. 分布	12	1. 主な外国での発売状況	21
5. 代謝	12	2. 海外における臨床支援情報	21
6. 排泄	13	X III. 備考	22
7. トランスポーターに関する情報	13	1. その他の関連資料	22
8. 透析等による除去率	13		

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

ベポタスチンベシル酸塩は選択的ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤であり、本邦では平成 12 年に上市されている。

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「DK」及びベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「DK」は、大興製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、平成 24 年 8 月に承認を得て、平成 30 年 6 月に発売に至った。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

ベポタスチンベシル酸塩は、抗アレルギー薬である。ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗作用を主体とし、ケミカルメディエーター（ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF 等）の産生・遊離抑制作用を現す。好酸球浸潤・増多抑制やインターロイキン-5 の産生抑制も示唆されている。<sup>1)</sup>

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」

#### (2) 洋名

Bepotastine Besilate Tablets 5mg 「DK」

Bepotastine Besilate Tablets 10mg 「DK」

#### (3) 名称の由来

「有効成分名」 + 「剤形」 + 「規格」 + 「屋号」 より命名した。

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

ベポタスチンベシル酸塩（JAN）

#### (2) 洋名（命名法）

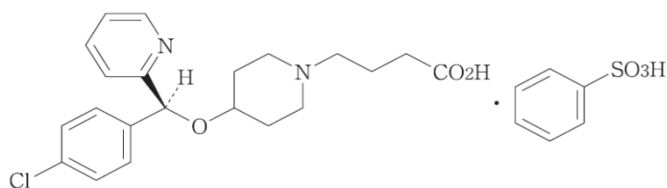
Bepotastine Besilate（JAN）

Bepotastine（INN）

#### (3) ステム

抗ヒスタミン薬：-astine

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>21</sub>H<sub>25</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>3</sub>・C<sub>6</sub>H<sub>6</sub>O<sub>3</sub>S

分子量：547.06

### 5. 化学名（命名法）

(S)-4-{4-[(4-Chlorophenyl)(pyridin-2-yl)methoxy]piperidin-1-yl}butanoic acid  
monobenzenesulfonate (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

### 7. CAS 登録番号

190786-44-8

### 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～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

酢酸(100)に極めて溶けやすく、水又はエタノール(99.5)にやや溶けにくい。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：159～163℃

##### (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

pH：本品 1 g を水 100 mL に溶かした液の pH は約 3.8 である。

#### 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

日本薬局方「ベポタスチンベシル酸塩」の確認試験法による

(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) 炎色反応試験（2）

(4) 塩化バリウム試液による沈殿反応

#### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方「ベポタスチンベシル酸塩」の定量法による



0.1mol/L 過塩素酸による電位差滴定法

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

区別：フィルムコーティング錠

販 売 名	ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」			ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」		
色・剤形	白色フィルムコーティング錠					
外 形	表面	裏面	側面	表面	裏面	側面
						
規 格	直径	厚さ	重量	直径	厚さ	重量
	6.1mm	2.7mm	84mg	7.1mm	3.0mm	125mg

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」

表：ベポタスチン「DK」、裏：5

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」

表：ベポタスチン「DK」、裏：10

#### (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

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」

1錠中 ベポタスチンベシル酸塩…5mg

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」

1錠中 ベポタスチンベシル酸塩…10mg

#### (2) 添加物

D-マンニトール、結晶セルロース、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、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、タルク

#### (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（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」及びベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」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。

##### 加速試験<sup>2)</sup>

試験条件：40±1℃、75±5%RH

試験製剤：紙箱入りのアルミパックした PTP 包装

##### (1) ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」

試験項目	規格	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠である	適合	適合	適合	適合
定量試験(%) <sup>注)</sup>	95.0～105.0	97.4～101.3	97.1～102.6	96.6～101.6	96.7～100.7

注) 3 ロット各 3 回測定 of 最小値～最大値

その他の試験項目（確認試験、純度試験、製剤均一性試験（含量均一性試験）、溶出試験）についても規格内であった。

##### (2) ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」

試験項目	規格	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠である	適合	適合	適合	適合
定量試験(%) <sup>注)</sup>	95.0～105.0	96.9～99.9	97.4～102.8	98.8～104.7	97.6～102.6

注) 3 ロット各 3 回測定 of 最小値～最大値

その他の試験項目（確認試験、純度試験、製剤均一性試験（含量均一性試験）、溶出試験）についても規格内であった。

#### 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）

該当資料なし

#### 7. 溶出性

##### (1) 溶出挙動における類似性

##### 1) ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」<sup>3)</sup>

「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）に基づき実施

試験方法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法

試験条件

試験液量：900mL

温度：37.0±0.5℃

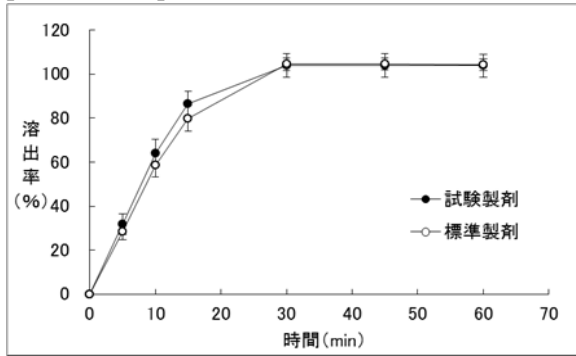
試験液：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水

回転数：50rpm (pH1.2、pH3.0、pH6.8、水)、100rpm (pH1.2)

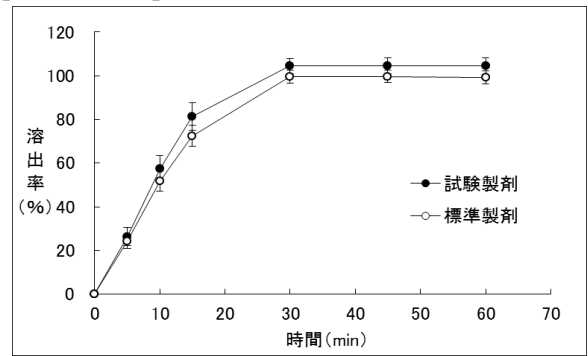
試験結果：全ての条件において判定基準に適合した。

<溶出曲線>

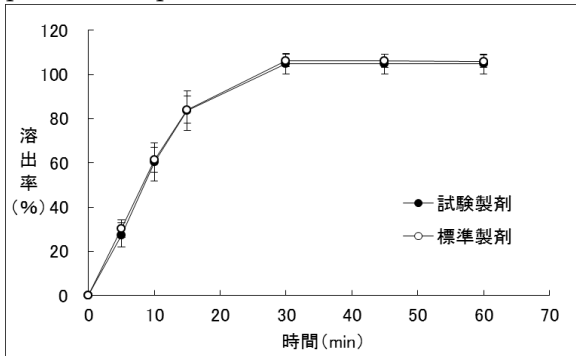
pH1.2、50rpm



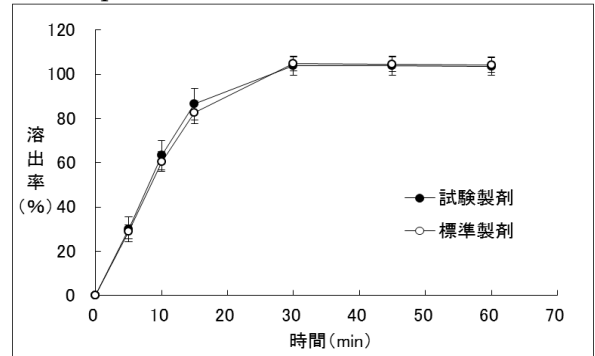
pH3.0、50rpm



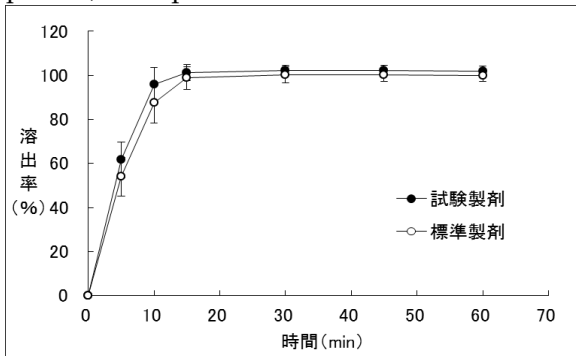
pH6.8、50rpm



水、50rpm



pH1.2、100rpm



(Mean ± S.D., n = 12)

2) ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」<sup>4)</sup>

「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」(平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号) に基づき実施

試験方法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法

試験条件

試験液量：900mL

温度：37.0±0.5℃

試験液：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水

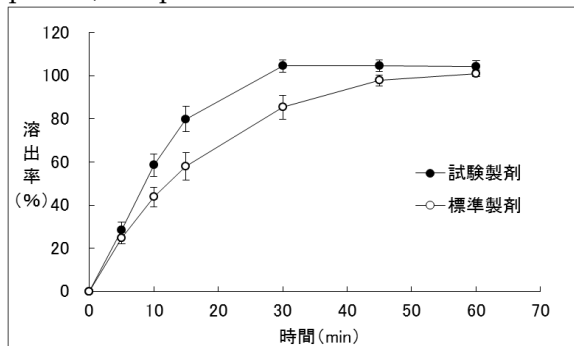
回転数：50rpm (pH1.2、pH3.0、pH6.8、水)、100rpm (pH1.2)

試験結果：5 条件中 1 条件において判定基準に適合しなかった。

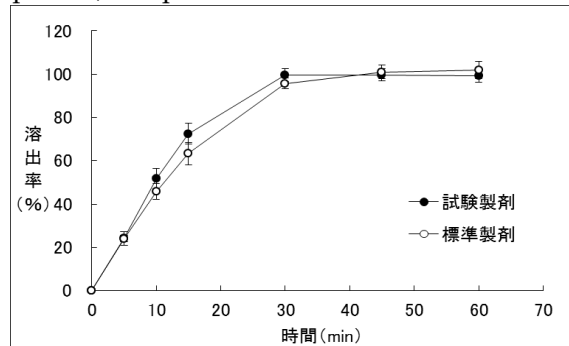
なお、ガイドラインでは、「溶出試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものでない」とされており、両製剤の体内薬物動態（生物学的同等性）を比較したところ、生物学的に同等と判定された。このことから、溶出率の違いは血中濃度に反映されず問題ないものであると考えられた。

<溶出曲線>

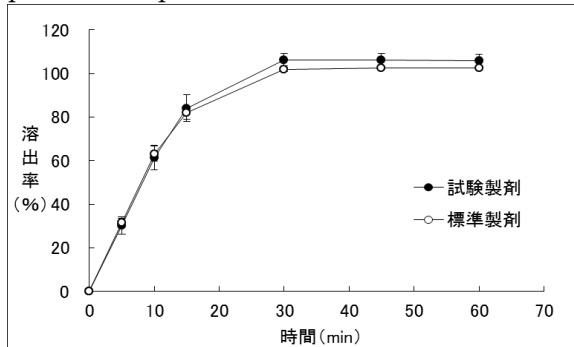
pH1.2、50rpm



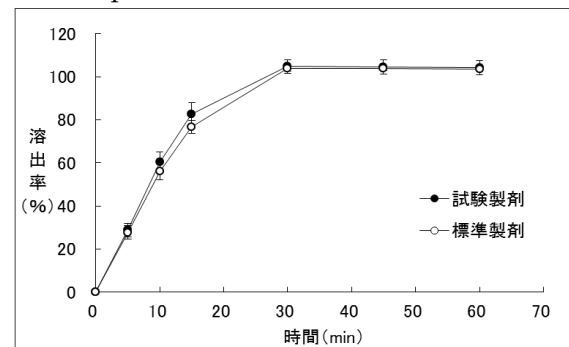
pH3.0、50rpm



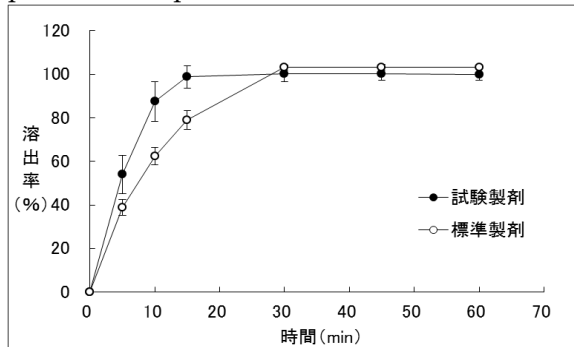
pH6.8、50rpm



水、50rpm



pH1.2、100rpm



(Mean ± S.D., n = 12)

(2) 公的溶出規格への適合性

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「DK」及びベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「DK」は、日本薬局方医薬品各条に定められたベポタスチンベシル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

日本薬局方「ベポタスチンベシル酸塩錠」の確認試験法による紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方「ベポタスチンベシル酸塩錠」の定量法による液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

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、皮膚疾患に伴う瘙痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症）

### 2. 用法及び用量

通常、成人にはベポタスチンベシル酸塩として1回10mgを1日2回経口投与する。

なお、年齢、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

該当しない

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

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

オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オキサトミド、ケトチフェンフマル酸塩、ロラタジン等のヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗剤

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

ベポタスチンベシル酸塩は、抗アレルギー薬である。ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗作用を主体とし、ケミカルメディエーター（ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF 等）の産生・遊離抑制作用を現す。好酸球浸潤・増多抑制やインターロイキン-5 の産生抑制も示唆されている。<sup>1)</sup>

#### (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

「VII. -1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験

##### 1) ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」<sup>3)</sup>

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」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、ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」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。

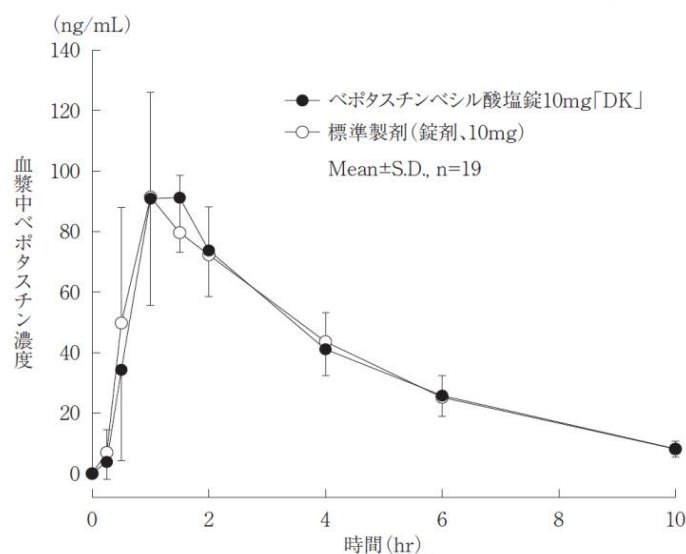
##### 2) ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」<sup>5)</sup>

「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」（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）に基づき実施

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ベポタスチンベシル酸塩として 10mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中ベポタスチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-10</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「DK」	373.12 ± 63.15	105.40 ± 25.12	1.4 ± 0.4	2.5 ± 0.4
標準製剤 (錠剤、10mg)	375.48 ± 55.28	102.55 ± 25.68	1.3 ± 0.8	2.5 ± 0.3

(Mean ± S.D., n=19)



血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

- (4) 中毒域  
該当資料なし
- (5) 食事・併用薬の影響  
該当資料なし
- (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) 解析方法

健康成人男子に単回経口投与した際の血漿中未変化体濃度推移は1-コンパートメントモデルで表すことができた。<sup>1)</sup>

### (2) 吸収速度定数

健康成人男子に単回経口投与した際の吸収速度定数  $K_a$  は  $5.10 \text{ hr}^{-1}$  であった。<sup>1)</sup>

### (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

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」  
 $0.27988 \pm 0.04052 \text{ (hr}^{-1}\text{)}$  (Mean  $\pm$  S.D., n=19)

### (5) クリアランス

健康成人男子に単回経口投与した際の見かけの全身クリアランス (CL/F) は  $27.9\text{L/hr}$  であった。<sup>1)</sup>

### (6) 分布容積

該当資料なし

### (7) 血漿蛋白結合率

健康成人男子に 10mg を単回経口投与したときの投与 1 及び 2 時間後の血漿タンパク結合率は 55.9 及び 55.0% であった。<sup>1)</sup>

## 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

「VIII.-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

### (3) 乳汁への移行性

「VIII.-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」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

## 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

主として腎臓から排泄される。（「Ⅷ.－9. 高齢者への投与」の項参照）

(2) 排泄率

健康成人男子に 10mg を単回経口投与したとき、血漿及び尿中に代謝物はほとんど認められず、投与後 24 時間までに投与量の 75～90%が未変化体として尿中に排泄された。<sup>1)</sup>

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

**【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

**慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)**

腎機能障害のある患者 [本剤の血中濃度を上昇させることがある。また、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、低用量(例えば1回量5mg)から投与するなど慎重に投与し、異常が認められた場合は減量、休薬するなど適切な処置を行う。]

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

**重要な基本的注意**

- (1) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械を操作する際には注意させること。
- (2) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量を図る場合には十分な管理下で徐々に行うこと。
- (3) 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。
- (4) 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

該当しない

### 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

該当資料なし

(3) その他の副作用

副作用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。	
	頻 度 不 明
血液	白血球数増加、白血球数減少、好酸球増多
精神神経系	眠気、倦怠感、頭痛、頭重感、めまい
消化器	口渇、悪心、胃痛、胃部不快感、下痢、口内乾燥、舌炎、嘔吐、腹痛、便秘
過敏症	発疹、腫脹、蕁麻疹
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -GTP、LDH、総ビリルビンの上昇
腎臓	尿潜血、尿蛋白、尿糖、尿ウロビリノーゲン、尿量減少、排尿困難、尿閉
その他	月経異常、浮腫、動悸、呼吸困難、しびれ、味覚異常

(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」の項参照
「VIII.-8. (3) その他の副作用」の項参照

9. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、一般に高齢者では生理機能が低下していることが多いため高い血中濃度が持続するおそれがあるので注意すること。

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、投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には、治療上の有益性が危険性を上まわ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おらず、また、動物実験で胎児への移行が認められている。]

(2) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず本剤を投与する場合には授乳を避けさせること。[動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。]

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小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

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

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

該当しない

## 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」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：該当しない

有効成分：該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

気密容器、室温保存（開封後は湿気を避けて保存すること）

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ-6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項参照

「Ⅷ-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

「Ⅷ-14. 適用上の注意」の項参照

患者向医薬品ガイド：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」

100錠（PTP10錠×10）

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」

100錠（PTP10錠×10）、500錠（PTP10錠×50）

### 7. 容器の材質

P T P：ポリ塩化ビニル、アルミニウム

ピロー：ポリエチレン、アルミニウム

バンド：ポリプロピレン

個装箱：紙

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：タリオン錠 5mg/10mg、タリオン OD 錠 5mg/10mg

同 効 薬：オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オキサトミド、ケトチフェンフマル酸塩、ロラタジン等のヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗剤

9. 国際誕生年月日

該当しない

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：2012年8月15日

承認番号

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」：22400AMX01355000

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」：22400AMX01356000

11. 薬価基準収載年月日

2018年6月15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（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」

HOT（9桁）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
126412801	4490022F1054	622641201

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」

HOT（9桁）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
126413501	4490022F2050	622641301

17. 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。

## X I . 文献

### 1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方解説書、廣川書店
- 2) 大興製薬(株)：ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」 及びベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」 の安定性に関する資料（社内資料）
- 3) 大興製薬(株)：ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「DK」 の生物学的同等性に関する資料（社内資料）
- 4) 大興製薬(株)：ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」 の溶出比較による生物学的同等性に関する資料（社内資料）
- 5) 大興製薬(株)：ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「DK」 の生物学的同等性に関する資料（社内資料）

### 2. その他の参考文献

該当資料なし



## X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況  
海外で発売されていない（2018年6月時点）
2. 海外における臨床支援情報  
該当資料なし

## XⅢ. 備考

1. その他の関連資料  
該当資料なし