

# 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「JG」 ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「JG」

### Bepotastine Besilate Tablets

剤形	錠剤（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	錠 5mg：1錠中 日局 ベポタスチンベシル酸塩 5mg 含有 錠 10mg：1錠中 日局 ベポタスチンベシル酸塩 10mg 含有
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15日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本ジェネリック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客様相談室 受付時間：9時～18時（土、日、祝日を除く） TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： <a href="https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/">https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/</a>

本IFは2022年7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、(独)医薬品医療機器総合機構(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」  
<https://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。この変更に合わせて、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(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」(<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) 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 PMDA 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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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 PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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	13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	13
1. 開発の経緯	1	14. その他	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1		
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	15
1. 販売名	2	1. 効能又は効果	15
(1)和名	2	2. 用法及び用量	15
(2)洋名	2	3. 臨床成績	15
(3)名称の由来	2	(1)臨床データパッケージ	15
2. 一般名	2	(2)臨床効果	15
(1)和名(命名法)	2	(3)臨床薬理試験	15
(2)洋名(命名法)	2	(4)探索的試験	15
(3)ステム	2	(5)検証的試験	15
3. 構造式又は示性式	2	1)無作為化並行用量反応試験	15
4. 分子式及び分子量	2	2)比較試験	15
5. 化学名(命名法)	2	3)安全性試験	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	4)患者・病態別試験	15
7. CAS登録番号	2	(6)治療の使用	15
III. 有効成分に関する項目	3	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)	15
1. 物理化学的性質	3	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	15
(1)外観・性状	3		
(2)溶解性	3	VI. 薬効薬理に関する項目	16
(3)吸湿性	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	16
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点	3	2. 薬理作用	16
(5)酸塩基解離定数	3	(1)作用部位・作用機序	16
(6)分配係数	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	16
(7)その他の主な示性値	3	(3)作用発現時間・持続時間	16
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	VII. 薬物動態に関する項目	17
4. 有効成分の定量法	3	1. 血中濃度の推移・測定法	17
IV. 製剤に関する項目	4	(1)治療上有効な血中濃度	17
1. 剤形	4	(2)最高血中濃度到達時間	17
(1)剤形の区別、外観及び性状	4	(3)臨床試験で確認された血中濃度	17
(2)製剤の物性	4	(4)中毒域	18
(3)識別コード	4	(5)食事・併用薬の影響	18
(4)pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等	4	(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	18
2. 製剤の組成	4	2. 薬物速度論的パラメータ	18
(1)有効成分(活性成分)の含量	4	(1)解析方法	18
(2)添加物	4	(2)吸収速度定数	18
(3)その他	4	(3)バイオアベイラビリティ	18
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	(4)消失速度定数	18
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	(5)クリアランス	18
5. 調製法及び溶解後の安定性	7	(6)分布容積	18
6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	7	(7)血漿蛋白結合率	19
7. 溶出性	8	3. 吸収	19
8. 生物学的試験法	13	4. 分布	19
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	13	(1)血液-脳関門通過性	19
10. 製剤中の有効成分の定量法	13	(2)血液-胎盤関門通過性	19
11. 力価	13	(3)乳汁への移行性	19
12. 混入する可能性のある夾雑物	13		

(4)髄液への移行性	19	2. 毒性試験	24
(5)その他の組織への移行性	19	(1)単回投与毒性試験	24
5. 代謝	19	(2)反復投与毒性試験	24
(1)代謝部位及び代謝経路	19	(3)生殖発生毒性試験	24
(2)代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の 分子種	19	(4)その他の特殊毒性	24
(3)初回通過効果の有無及びその割合	19	<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	25
(4)代謝物の活性の有無及び比率	19	1. 規制区分	25
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	19	2. 有効期間又は使用期限	25
6. 排泄	19	3. 貯法・保存条件	25
(1)排泄部位及び経路	19	4. 薬剤取扱い上の注意点	25
(2)排泄率	19	(1)薬局での取扱い上の留意点について	25
(3)排泄速度	19	(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)	25
7. トランスポーターに関する情報	20	(3)調剤時の留意点について	25
8. 透析等による除去率	20	5. 承認条件等	25
<b>VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目</b>	21	6. 包装	25
1. 警告内容とその理由	21	7. 容器の材質	25
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	21	8. 同一成分・同効薬	25
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と その理由	21	9. 国際誕生年月日	26
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と その理由	21	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	26
5. 慎重投与内容とその理由	21	11. 薬価基準収載年月日	26
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	21	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	26
7. 相互作用	21	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及び その内容	26
(1)併用禁忌とその理由	21	14. 再審査期間	26
(2)併用注意とその理由	21	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	26
8. 副作用	22	16. 各種コード	26
(1)副作用の概要	22	17. 保険給付上の注意	26
(2)重大な副作用と初期症状	22	<b>X I. 文献</b>	27
(3)その他の副作用	22	1. 引用文献	27
(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異 常一覧	22	2. その他の参考文献	27
(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	22	<b>X II. 参考資料</b>	28
(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法	22	1. 主な外国での発売状況	28
9. 高齢者への投与	22	2. 海外における臨床支援情報	28
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	22	<b>X III. 備考</b>	29
11. 小児等への投与	23	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	29
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	23	(1)粉碎	29
13. 過量投与	23	(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通 過性	30
14. 適用上の注意	23	2. その他の関連資料	31
15. その他の注意	23		
16. その他	23		
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	24		
1. 薬理試験	24		
(1)薬効薬理試験 (「VI. 薬効薬理に関する 項目」参照)	24		
(2)副次的薬理試験	24		
(3)安全性薬理試験	24		
(4)その他の薬理試験	24		

# 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錠 5mg「JG」及びベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「JG」はベポタスチンベシル酸塩を含有する選択的ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。

本邦でベポタスチンベシル酸塩錠は 2000 年に上市されている。

本剤は日本ジェネリック株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について（平成 17 年 3 月 31 日 薬食発第 0331015 号）」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、2012 年 8 月に製造販売承認を得て、2018 年 6 月に販売開始した。2019 年 11 月に、小児に対する効能・効果、用法・用量が追加承認された。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 錠剤本体の両面に成分名（ベポタスチン）、含量及び屋号を印字し、識別性を向上させている。
- (2) 副作用については「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 - 8. 副作用 (3) その他の副作用」の項参照

## 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 「JG」
- ・ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」

#### (2) 洋名

- ・Bepotastine Besilate Tablets 5mg “JG”
- ・Bepotastine Besilate Tablets 10mg “JG”

#### (3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」 より命名

### 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)

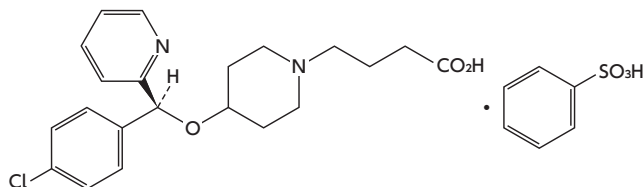
Bepotastine Besilate (JAN)

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

特になし

### 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

1g を水 100mL 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

日局「ベポタスチンベシル酸塩」の確認試験による。

- (1) 紫外可視吸光度測定法：262nm に吸収の極大を示し、262nm における  $E_{1\text{cm}}^{1\%}$  は約 113 である。<sup>1)</sup>
- (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）（塩素の定性反応）
- (4) ベンゼンスルホン酸の確認試験

#### 4. 有効成分の定量法

日局「ベポタスチンベシル酸塩」の定量法による。

電位差滴定法







0.1mol/L 過塩素酸 1mL = 54.71mg  $\text{C}_{21}\text{H}_{25}\text{ClN}_2\text{O}_3 \cdot \text{C}_6\text{H}_6\text{O}_3\text{S}$



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「JG」	ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」
色・剤形	白色のフィルムコーティング錠	
外形	  	  
大きさ (mm)	直径：6.1 厚さ：2.7	直径：7.1 厚さ：3.0
重量 (mg)	84	125

#### (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 「JG」  
錠剤本体に記載：ベポタスチン 5 JG
- ・ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」  
錠剤本体に記載：ベポタスチン 10 JG

#### (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 「JG」  
1 錠中 日局 ベポタスチンベシル酸塩 5mg 含有
- ・ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」  
1 錠中 日局 ベポタスチンベシル酸塩 10mg 含有

#### (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 (105) ポリオキシプロピレン (5) 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

##### ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「JG」

###### ◎ 加速試験<sup>2)</sup>

包装形態：PTP/アルミピロー包装

保存条件：40±1℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験

試験項目	性状	確認試験	純度試験		製剤均一性試験	溶出試験 (%)	定量試験 (%)
			(3)	(4)			
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)
試験開始時	適合	適合	適合	適合	適合	105	98.9
1 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	—	105	100.0
3 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	—	102	100.0
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	101	99.1

(1) 白色のフィルムコーティング錠である。

(2) 紫外可視吸光度測定法：波長 260～264nm に吸収の極大を示す。

(3) 類縁物質：RRT\*約 0.8 及び約 0.9 の類縁物質はそれぞれ 0.25%以下、ベンゼンスルホン酸以外の個々の類縁物質は 0.2%以下、総類縁物質の合計は 1.0%以下である。

(4) 類縁物質：異性体 (R 体) は 0.5%以下

(5) 含量均一性試験：判定値が 15.0%を超えない。

(6) 30 分間、85%以上 (水 900mL、パドル法、50rpm)

(7) 表示量の 95.0～105.0%

※ベポタスチンに対する相対保持時間

最終包装製品を用いた加速試験 (40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月) の結果、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。

###### ◎ 無包装状態での安定性試験<sup>3)</sup>

試験条件：①温度に対する安定性試験：40±2℃、3 ヶ月 (遮光・気密容器)

②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、3 ヶ月 (遮光・開放)

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lux・hr (1000lux・気密容器)

試験項目：性状、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目		性状	溶出試験 (%)	定量試験 (%)	硬度 (Kg)
規格		(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時		適合	99.6～102.0	100.7	7.9
①温度	1 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	2 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	3 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

試験項目	性状	溶出試験 (%)	定量試験 (%)	硬度 (Kg)
規格	(1)	(2)	(3)	(4)
②湿度	1 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし
	2 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし
	3 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし
③光	60 万 lux・hr	変化なし	変化なし	変化なし
	120 万 lux・hr	変化なし	変化なし	変化なし

- (1) 白色のフィルムコーティング錠である。  
(2) 30 分間、85%以上 (水 900mL、パドル法、50rpm)  
(3) 表示量の 95.0~105.0%  
(4) 参考値

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について (答申) 平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

### ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」

#### ◎ 加速試験<sup>4)</sup>

包装形態：PTP/アルミピロー包装

保存条件：40±1℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験

試験項目	性状	確認試験	純度試験		製剤均一性試験	溶出試験 (%)	定量試験 (%)
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)
試験開始時	適合	適合	適合	適合	適合	100	98.6
1 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	—	100	99.8
3 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	—	100	100.6
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	100	100.1

- (1) 白色のフィルムコーティング錠である。  
(2) 紫外可視吸光度測定法：波長 260~264nm に吸収の極大を示す。  
(3) 類縁物質：RRT\*約 0.8 及び約 0.9 の類縁物質はそれぞれ 0.25%以下、ベンゼンスルホン酸以外の個々の類縁物質は 0.2%以下、総類縁物質の合計は 1.0%以下である。  
(4) 類縁物質：異性体 (R 体) は 0.5%以下  
(5) 含量均一性試験：判定値が 15.0%を超えない。  
(6) 30 分間、85%以上 (水 900mL、パドル法、50rpm)  
(7) 表示量の 95.0~105.0%

※ベポタスチンに対する相対保持時間

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、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。

◎ 無包装状態での安定性試験<sup>5)</sup>

試験条件：①温度に対する安定性試験：40±2℃、3 ヶ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、3 ヶ月（遮光・開放）

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lux・hr（1000lux・気密容器）

試験項目：性状、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目		性状	溶出試験 (%)	定量試験 (%)	硬度 (Kg)
規格		(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時		適合	93.9~102.2	100.4	9.0
①温度	1 ヶ月後	変化なし	変化あり（規格内： 78.6*~101.0）	変化なし	変化なし
	2 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	3 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
②湿度	1 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	2 ヶ月後	変化なし	変化あり（規格内： 71.3*~101.2）	変化なし	変化なし
	3 ヶ月後	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
③光	60 万 lux・hr	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	120 万 lux・hr	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

- (1) 白色のフィルムコーティング錠である。
- (2) 30 分間、85%以上（水 900mL、パドル法、50rpm）
- (3) 表示量の 95.0~105.0%
- (4) 参考値

※12 個中 11 個が規格を満たしたため、規格内とした。

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

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

【溶出挙動の同等性又は類似性】

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「JG」<sup>6)</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 別紙 2 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（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）」に従う。

- ・ 標準製剤：ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」
- ・ 処方変更水準：B 水準

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	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液
			pH3.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	日本薬局方 溶出試験第 2 液
			水	日本薬局方 精製水
	100rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液	
試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

### ・ 判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	pH1.2	(1) 平均溶出率 標準製剤の平均溶出率が約 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。 (2) 個々の溶出率 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。
	pH3.0	
	pH6.8	
	水	
100	pH1.2	(1) 平均溶出率 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) 個々の溶出率 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。

・試験結果

<p>(50rpm、pH1.2)</p> <table border="1"> <caption>50rpm, pH1.2 Data</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>試験剤 (5mg [JG]) (%)</th> <th>標準剤 (10mg [JG]) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>30</td><td>28</td></tr> <tr><td>10</td><td>65</td><td>60</td></tr> <tr><td>15</td><td>85</td><td>80</td></tr> <tr><td>30</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>45</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>60</td><td>100</td><td>100</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)	0	0	0	5	30	28	10	65	60	15	85	80	30	100	100	45	100	100	60	100	100	<p>(50rpm、pH3.0)</p> <table border="1"> <caption>50rpm, pH3.0 Data</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>試験剤 (5mg [JG]) (%)</th> <th>標準剤 (10mg [JG]) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>25</td><td>22</td></tr> <tr><td>10</td><td>55</td><td>50</td></tr> <tr><td>15</td><td>80</td><td>75</td></tr> <tr><td>30</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>45</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>60</td><td>100</td><td>100</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)	0	0	0	5	25	22	10	55	50	15	80	75	30	100	100	45	100	100	60	100	100
時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)																																															
0	0	0																																															
5	30	28																																															
10	65	60																																															
15	85	80																																															
30	100	100																																															
45	100	100																																															
60	100	100																																															
時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)																																															
0	0	0																																															
5	25	22																																															
10	55	50																																															
15	80	75																																															
30	100	100																																															
45	100	100																																															
60	100	100																																															
<p>判定時点である 10 分及び 15 分において、試験剤の平均溶出率は標準剤の平均溶出率の ±10% の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である 10 分及び 15 分において、試験剤の平均溶出率は標準剤の平均溶出率の ±10% の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>																																																
<p>(50rpm、pH6.8)</p> <table border="1"> <caption>50rpm, pH6.8 Data</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>試験剤 (5mg [JG]) (%)</th> <th>標準剤 (10mg [JG]) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>28</td><td>25</td></tr> <tr><td>10</td><td>60</td><td>55</td></tr> <tr><td>15</td><td>82</td><td>78</td></tr> <tr><td>30</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>45</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>60</td><td>100</td><td>100</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)	0	0	0	5	28	25	10	60	55	15	82	78	30	100	100	45	100	100	60	100	100	<p>(50rpm、水)</p> <table border="1"> <caption>50rpm, Water Data</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>試験剤 (5mg [JG]) (%)</th> <th>標準剤 (10mg [JG]) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>28</td><td>25</td></tr> <tr><td>10</td><td>60</td><td>55</td></tr> <tr><td>15</td><td>82</td><td>78</td></tr> <tr><td>30</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>45</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>60</td><td>100</td><td>100</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)	0	0	0	5	28	25	10	60	55	15	82	78	30	100	100	45	100	100	60	100	100
時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)																																															
0	0	0																																															
5	28	25																																															
10	60	55																																															
15	82	78																																															
30	100	100																																															
45	100	100																																															
60	100	100																																															
時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)																																															
0	0	0																																															
5	28	25																																															
10	60	55																																															
15	82	78																																															
30	100	100																																															
45	100	100																																															
60	100	100																																															
<p>判定時点である 10 分及び 15 分において、試験剤の平均溶出率は標準剤の平均溶出率の ±10% の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である 10 分及び 15 分において、試験剤の平均溶出率は標準剤の平均溶出率の ±10% の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>																																																
<p>(100rpm、pH1.2)</p> <table border="1"> <caption>100rpm, pH1.2 Data</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>試験剤 (5mg [JG]) (%)</th> <th>標準剤 (10mg [JG]) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>55</td><td>50</td></tr> <tr><td>10</td><td>95</td><td>85</td></tr> <tr><td>15</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>30</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>45</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>60</td><td>100</td><td>100</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)	0	0	0	5	55	50	10	95	85	15	100	100	30	100	100	45	100	100	60	100	100																									
時間 (分)	試験剤 (5mg [JG]) (%)	標準剤 (10mg [JG]) (%)																																															
0	0	0																																															
5	55	50																																															
10	95	85																																															
15	100	100																																															
30	100	100																																															
45	100	100																																															
60	100	100																																															
<p>判定時点である 15 分において、試験剤が平均 85% 以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>																																																	

溶出挙動の同等性の判定（平均溶出率）

回転数 (rpm)	試験液	判定 時点 (min)	平均溶出率 (%)		判定
			標準製剤（ベポタスチンベ シル酸塩錠 10mg「JG」）	試験製剤（ベポタスチンベ シル酸塩錠 5mg「JG」）	
50	pH1.2	10	58.5	63.9	適合
		15	79.9	86.3	
	pH3.0	10	51.8	57.4	適合
		15	72.5	81.2	
	pH6.8	10	61.4	60.3	適合
		15	84.1	83.6	
	水	10	60.5	63.4	適合
		15	82.7	86.5	
100	pH1.2	15	98.8	101.3	適合

溶出挙動の同等性の判定（個々の溶出率）

回転数 (rpm)	試験液	判定 時点 (min)	個々の溶出率 (%)	平均溶出率との差		判定
			最小値～最大値	±15%超	±25%超	
50	pH1.2	15	78.1～96.9	0 個	0 個	適合
	pH3.0	15	68.2～89.5	0 個	0 個	適合
	pH6.8	15	67.8～94.8	1 個	0 個	適合
	水	15	71.0～94.9	1 個	0 個	適合
100	pH1.2	15	91.9～106.6	0 個	0 個	適合

・ 結論

試験製剤と標準製剤の溶出挙動の同等性を判定したところ、いずれの試験条件においても「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」の判定基準に適合していた。

以上より、両製剤は生物学的に同等とみなされた。

## ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」<sup>7)</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）」に従う。

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	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液
			pH3.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	日本薬局方 溶出試験第 2 液
			水	日本薬局方 精製水
	100rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液	
試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

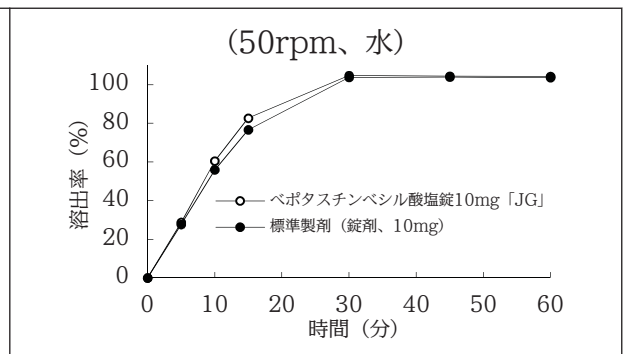
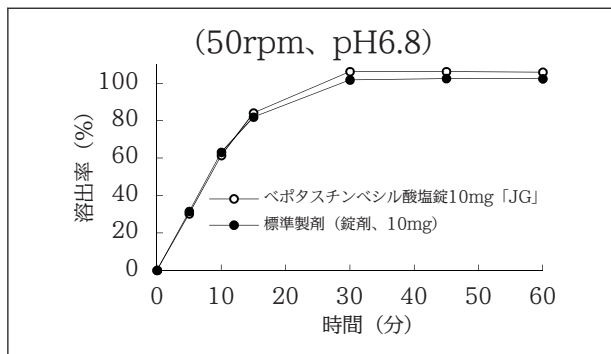
### ・判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	pH1.2	標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 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±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。
	pH3.0	
	pH6.8	
	水	
100	pH1.2	

### ・試験結果

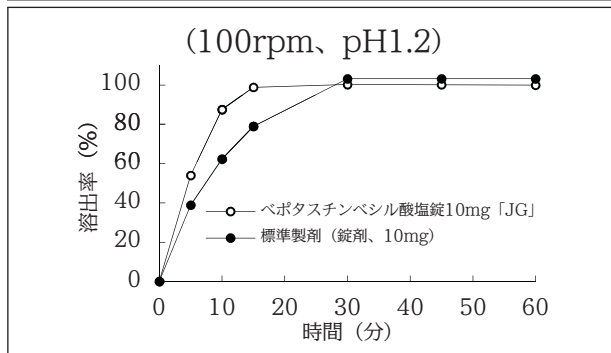
試験条件	結果
<p>(50rpm, pH1.2)</p>	<p>判定時点である 15 分及び 30 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±15%の範囲外であり、ガイドラインの判定基準に適合しなかった。</p>
<p>(50rpm, pH3.0)</p>	<p>判定時点である 15 分及び 30 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±15%の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>





判定時点である 10 分及び 15 分において、試験剤の平均溶出率は標準剤の平均溶出率の ±15% の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。

判定時点である 10 分及び 15 分において、試験剤の平均溶出率は標準剤の平均溶出率の ±15% の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。



判定時点である 10 分及び 15 分において、試験剤の平均溶出率は標準剤の平均溶出率の ±15% の範囲外であり、ガイドラインの判定基準に適合しなかった。

溶出挙動の類似性の判定 (平均溶出率)

回転数 (rpm)	試験液	判定時点 (min)	平均溶出率 (%)		判定
			標準剤 (錠剤、10mg)	試験剤 (ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」)	
50	pH1.2	15	58.0	79.9	不適合
		30	85.3	104.4	
	pH3.0	15	63.3	72.5	適合
		30	95.7	99.6	
	pH6.8	10	63.1	61.4	適合
		15	81.9	84.1	
水	10	56.0	60.5	適合	
	15	76.7	82.7		
100	pH1.2	10	62.3	87.5	不適合
		15	79.0	98.8	

・ 結論

標準製剤と試験製剤の平均溶出率を比較したところ、50rpm 及び 100rpm の pH1.2 において判定基準に適合しなかった。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動は類似でないと判断した。

しかし、生物学的同等性試験ガイドラインにおいて、「本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」と記載されている。試験製剤の溶出挙動は、標準製剤の溶出挙動と類似していないと判定されたが、体内薬物動態を確認したところ、両製剤の生物学的同等性が確認された。

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 -1.血中濃度の推移・測定法(3)臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

【公的溶出規格への適合性】

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「JG」 及びベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」 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。

試験方法	日局 一般試験法溶出試験法（パドル法）
試験条件	回転数：50rpm 試験液：水 試験液量：900mL
分析法	液体クロマトグラフィー
溶出規格	30 分間、85%以上

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「ベポタスチンベシル酸塩錠」の確認試験による。

紫外可視吸光度測定法：波長 260～264nm に吸収の極大を示す。

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「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

＜成人＞

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）

＜小児＞

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚瘙癢症）に伴う瘙痒

### 2. 用法及び用量

＜成人＞

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。

＜小児＞

通常、7歳以上の小児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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (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

ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗剤（エバスタチン 等）

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

抗アレルギー薬。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

健康成人男子

薬剤名	投与量	投与方法	Tmax (hr)
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」	1 錠 (ベポタスチンベシル酸塩として10mg)	絶食単回経口投与	1.4±0.4

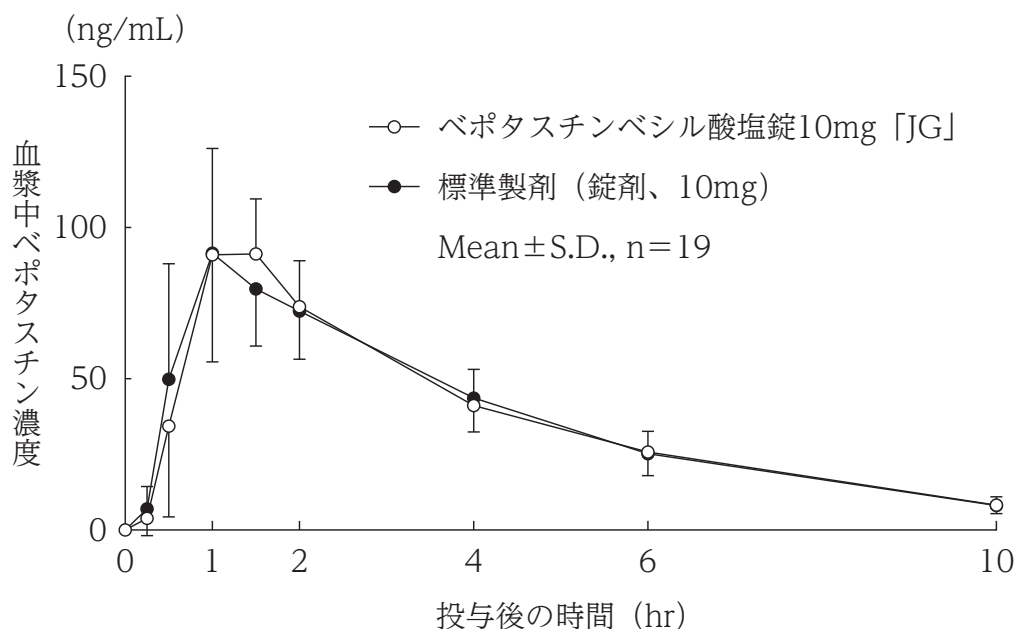
(Mean±S.D.,n=19)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

【生物学的同等性試験】<sup>8)</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）」に従う。

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」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未変化体濃度を測定し、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) ~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。



<薬物動態パラメータ>

	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 「JG」	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。

<同等性の判定結果>

	AUC <sub>0-10</sub>	Cmax
2 製剤の平均値の差	log (0.9920)	log (1.0338)
90%信頼区間	log (0.9501) ~log (1.10356)	log(0.9486)~log(1.1266)

(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

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

健康成人男子

薬剤名	投与量	投与方法	kel (hr <sup>-1</sup> )
ベポタスチンベシル酸塩 錠 10mg 「JG」	1 錠 (ベポタスチンベシル酸塩 として 10mg)	絶食単回 経口投与	0.2799±0.041

(Mean±S.D.,n=19)

(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

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. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 10. 妊娠、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

### (3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 10. 妊娠、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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 9. 高齢者への投与」の項参照

健康成人男子に 10mg を単回経口投与したとき、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出された。<sup>1)</sup>

### (2) 排泄率

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6. 排出（1）排泄部位及び経路」の項参照

### (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。  
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。

### (2) 重大な副作用と初期症状

該当しない

### (3) その他の副作用

	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) 上昇、ALT (GPT) 上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、LDH 上昇、総ビリルビン上昇
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. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）、-8. 副作用（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、乳児又は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）。<sup>9)</sup>

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

## 13. 過量投与

該当しない

## 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	ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「JG」 ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」	該当しない
有効成分	ベポタスチンベシル酸塩	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

室温保存、気密容器

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

#### (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. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 14. 適用上の注意」の項参照

- ・患者向医薬品ガイド：有り
- ・くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

##### 【取扱い上の注意】

##### 1. 保存方法

アルミピロー開封後は湿気を避けて保存すること。

### 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 「JG」  
PTP：100錠（10錠×10）
- ・ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」  
PTP：100錠（10錠×10）、500錠（10錠×50）

### 7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム・アルミニウム箔（PTP）、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム（ピロー）、紙箱

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：タリオン<sup>®</sup>錠 5mg/錠 10mg/OD錠 5mg/OD錠 10mg（田辺三菱製薬）

同 効 薬：オキサトミド、エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、セチリジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、ロラタジン、レボセチリジン等

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

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「JG」	2012年8月15日	22400AMX01267000
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「JG」	2012年8月15日	22400AMX01265000

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

販売名	内容
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg/10mg「JG」	承認年月日：2019年11月20日 内容：小児に対する効能・効果、用法・用量を追加した。

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

販売名	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
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「JG」	126341101	4490022F1062	622634101
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「JG」	126342801	4490022F2069	622634201

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、C-5025 (2016)、廣川書店
- 2)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「JG」の加速試験
- 3)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「JG」の無包装状態の安定性試験
- 4)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「JG」の加速試験
- 5)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「JG」の無包装状態の安定性試験
- 6)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「JG」の溶出試験
- 7)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「JG」の溶出試験
- 8)日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「JG」の生物学的同等性試験
- 9)馬場駿吉：臨床医薬,18 (12) ,1371-1387,2002

## 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

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

# 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。

### (1) 粉砕

#### 1. 保存条件

温度に対する安定性試験：40±2℃、1 ヶ月〔遮光・気密容器〕

湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、1 ヶ月〔遮光・開放〕

光に対する安定性試験：60 万 lx・hr (1000lx・25 日)〔気密容器〕

#### 2. 試験項目

性状、含量

#### 3. 試験結果

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「JG」

		製剤の規格 (参考)	試験開始時	0.5 ヶ月後	1 ヶ月後
温度	性状	白色のフィルムコーティング錠	白色の粉末	白色の粉末	白色の塊を含む粉末
	含量 (%)	表示量の 95.0~105.0% [開始時 100%]	100.7 [100]	98.7 [98.0]	99.7 [99.0]
湿度	性状	白色のフィルムコーティング錠	白色の粉末	白色の塊を含む粉末	白色の塊を含む粉末
	含量 (%)	表示量の 95.0~105.0% [開始時 100%]	100.7 [100]	99.7 [99.0]	99.8 [99.1]

		製剤の規格 (参考)	試験開始時	60 万 lx・hr
光	性状	白色のフィルムコーティング錠	白色の粉末	白色の粉末
	含量 (%)	表示量の 95.0~105.0% [開始時 100%]	100.7 [100]	97.3 [96.6]

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」

		製剤の規格 (参考)	試験開始時	0.5 ヶ月後	1 ヶ月後
温度	性状	白色のフィルムコーティング錠	白色の粉末	白色の粉末	白色の塊を含む粉末
	含量 (%)	表示量の 95.0~105.0% [開始時 100%]	100.4 [100]	100.8 [100.4]	99.4 [99.0]
湿度	性状	白色のフィルムコーティング錠	白色の粉末	白色の塊を含む粉末	白色の塊を含む粉末
	含量 (%)	表示量の 95.0~105.0% [開始時 100%]	100.4 [100]	100.6 [100.2]	100.4 [100.0]

		製剤の規格 (参考)	試験開始時	60 万 lx・hr
光	性状	白色のフィルムコーティング錠	白色の粉末	白色の粉末
	含量 (%)	表示量の 95.0~105.0% [開始時 100%]	100.4 [100]	99.1 [98.7]

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

1. 試験方法

崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、①約 55℃の温湯又は②約 20℃の水 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。

10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、攪拌操作（ディスペンサーを逆さにする、縦に振るなど崩壊するように工夫した操作を最大 1 分）を行う。

これらの操作で崩壊・懸濁しない場合、錠剤のフィルムコーティングを破壊（乳棒で 15 回程度たたく）して、上記と同様の操作を行う。

通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管栄養チューブの注入端より 2~3mL/秒の速度で注入し、チューブの通過性を確認する。チューブサイズは 8Fr.、12Fr.、14Fr.、16Fr.、18Fr. と通過するまで変更する。

## 2. 試験結果

### ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「JG」

#### 崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「JG」	①約 55℃の温湯：錠剤を破壊後、10 分以内に崩壊・懸濁した。 ②約 20℃の水：錠剤を破壊後、10 分経過した後、攪拌操作で崩壊・懸濁した。

#### 通過性試験結果

品目名	通過性
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg 「JG」	①約 55℃の温湯：8Fr.のチューブを通過した。 ②約 20℃の水：8Fr.のチューブを通過した。

8Fr.：8 フレンチ 約 2.7mm <外径>

### ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」

#### 崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」	①約 55℃の温湯：錠剤を破壊後、10 分以内に崩壊・懸濁した。 ②約 20℃の水：錠剤を破壊後、10 分経過した後、攪拌操作で崩壊・懸濁した。

#### 通過性試験結果

品目名	通過性
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg 「JG」	①約 55℃の温湯：8Fr.のチューブを通過した。 ②約 20℃の水：8Fr.のチューブを通過した。

8Fr.：8 フレンチ 約 2.7mm <外径>

## 3. 備考

本製剤は、マクロゴール 6000 を含有する製剤である。マクロゴール 6000 含有の製剤は、マクロゴール 6000 が 56～61℃で凝固するため温度を高くしすぎるとチューブに入る前に固まってしまう可能性が考えられる。

## 2. その他の関連資料

該当資料なし

*Memo*

*Memo*

*Memo*



日本ジェネリック株式会社

東京都千代田区丸の内一丁目9番1号