

めまい・平衡障害治療剤

日本薬局方 ベタヒスチンメシル酸塩錠

※ **ベタヒスチンメシル酸塩錠6mg「TSU」**
ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「TSU」
 Betahistine Mesilate Tablets 「TSU」

規 制 区 分	
処方箋医薬品(注意—医師等の処方箋により使用すること)	
貯 法	本剤は吸湿性のため湿気を避けて室温保存
使用期限	外箱、容器に表示

	※6mg錠	12mg錠
承認番号	22500AMX 00736000	22400AMX 00176000
薬価収載	2013年6月	2012年6月
販売開始	1978年4月	2012年6月







【組成・性状】

組 成

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg「TSU」は1錠中ベタヒスチンメシル酸塩 6mg および添加物として乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、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、タルク、酸化チタン、カルナウバロウを含有する。
 ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg「TSU」は1錠中ベタヒスチンメシル酸塩 12mg および添加物としてタルク、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸カルシウムを含有する。

製剤の性状

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg「TSU」は白色のフィルムコート錠で、識別記号はTSU562である。
 ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg「TSU」は片面割線を有する白色の素錠で識別記号はTSU571である。

			直径：約7.1mm 厚さ：約4.1mm 質量：約145mg
			直径：約8.0mm 厚さ：約3.0mm 質量：約200mg

【効能・効果】

下記の疾患に伴うめまい、めまい感
 メニエール病、メニエール症候群、眩暈症

【用法・用量】

錠 6mg：成人1回1～2錠(ベタヒスチンメシル酸塩として6～12mg)を1日3回食後経口投与する。
 錠 12mg：通常、成人は1回1錠(ベタヒスチンメシル酸塩として12mg)を1日3回食後経口投与する。(なお、ベタヒスチンメシル酸塩としての1回の用量は6～12mgである。)
 ただし、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

- (1) 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
- 消化性潰瘍の既往歴のある患者及び活動性の消化性潰瘍のある患者〔本剤はヒスタミン類似作用を有するため、H₂受容体を介して胃酸分泌亢進を引き起こすおそれがある。〕
 - 気管支喘息の患者〔本剤はヒスタミン類似作用を有するため、H₁受容体を介して気道の収縮を引き起こすおそれがある。〕
 - 褐色細胞腫のある患者〔本剤はヒスタミン類似作用を有するため、アドレナリンの過剰分泌により血圧上昇を引き起こすおそれがある。〕
- (2) 副作用
 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。

その他の副作用

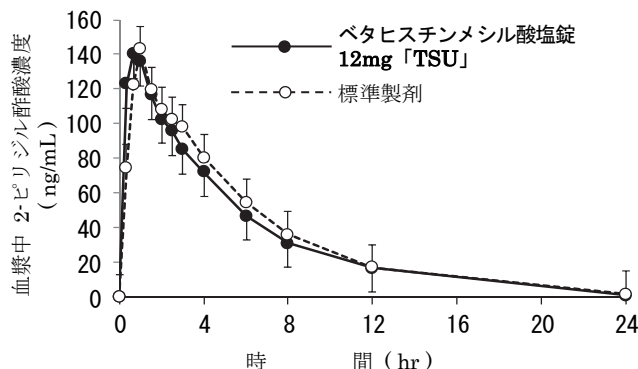
	頻 度 不 明
消化器	悪心・嘔吐
過敏症*	発疹

*：このような症状があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

- (3) 高齢者への投与
 一般に高齢者では生理機能が低下しているため減量するなど注意すること。
- (4) 妊婦、産婦、授乳婦等への投与
 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断された場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (5) 小児等への投与
 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。)
- (6) 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、更には穿孔を起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。)

【薬物動態】

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg「TSU」と標準製剤をクロスオーバー法により、それぞれ1錠(ベタヒスチンメシル酸塩として12mg)を健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中2-ピリジル酢酸(ベタヒスチンメシル酸塩の主代謝物)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(0.8)～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¹⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「TSU」	805.1±67.1	169.9±15.0	0.80±0.13	4.65±0.66
標準製剤(錠剤、12mg)	849.8±54.8	162.0±11.5	1.30±0.20	4.14±0.30

(mean±S.E. n=17)

溶出挙動

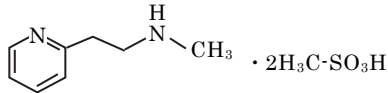
ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg「TSU」²⁾、ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg「TSU」³⁾ は、日本薬局方医薬品各条に定められたベタヒスチンメシル酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

モルモットを用いた実験で蝸牛放射状細動脈の血流量を増加させる作用が認められ、特に病的状態下での効果が顕著である⁴⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：ベタヒスチンメシル酸塩 (Betahistine Mesilate)

化学名：N-Methyl-2-pyridin-2-ylethylamine
dimethanesulfonate

分子式：C₈H₁₂N₂ · 2CH₄O₃S

分子量：328.41

融 点：110～114℃ (乾燥後)

性 状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。

本品は水に極めて溶けやすく、酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けにくい。

本品は希塩酸に溶ける。

本品は吸湿性である。

【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験 (室温、3年) の結果、ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg「TSU」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された⁵⁾。

最終包装製品を用いた長期保存試験 (25℃、60%RH、3年) の結果、ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg「TSU」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された⁶⁾。

【包 装】

※※錠 6mg：(PTP) 100錠、1000錠
(バラ) 1200錠

錠 12mg：(PTP) 100錠

【主要文献】

- 1) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 2) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 3) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 4) 斉藤等 他：耳鼻臨床，60，1112 (1967)
- 5) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 6) 鶴原製薬株式会社 社内資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料についても下記へご請求ください。

鶴原製薬株式会社 医薬情報部

〒563-0036 大阪府池田市豊島北1丁目16番1号

TEL：072-761-1456 (代表) FAX：072-760-5252



製造販売元
鶴原製薬株式会社
大阪府池田市豊島北1丁目16番1号

(P 4)
(P 2 6) - 5 4 2 3 - 2 1 0 9
A 1 0 9 - S