

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_{H₁}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「KN」

ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」

BEPOTASTINE BESILATE Tablets 5mg「KN」・10mg「KN」

ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」

ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」

BEPOTASTINE BESILATE OD Tablets 5mg「KN」・10mg「KN」

ベポタスチンベシル酸塩口腔内崩壊錠

剤形	ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「KN」・10mg「KN」：フィルムコーティング錠 ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」・10mg「KN」：素錠（口腔内崩壊錠）				
製剤の規制区分	該当しない				
規格・含量	錠/OD錠5mg「KN」：1錠中、日局ベポタスチンベシル酸塩5mg含有 錠/OD錠10mg「KN」：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	製造販売一部変更承認年月日	薬価基準収載年月日	発売年月日
	錠5mg「KN」	2018年2月15日	2019年11月20日 (効能・効果、用法・用量追加による)	2018年6月15日	2018年6月15日
	錠10mg「KN」	2018年2月15日	2019年11月20日 (効能・効果、用法・用量追加による)	2018年6月15日	2018年6月15日
	OD錠5mg「KN」	2018年2月15日	2019年11月20日 (効能・効果、用法・用量追加による)	2018年6月15日	2018年9月3日
	OD錠10mg「KN」	2018年2月15日	2019年11月20日 (効能・効果、用法・用量追加による)	2018年6月15日	2018年9月3日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：小林化工株式会社				
医薬情報担当者の連絡先					
問い合わせ窓口	小林化工株式会社 学術部 ☎ 0120-37-0690、TEL：0776-73-0901、FAX：0776-73-0677 医療関係者向けホームページ： https://www.kobayashikako.co.jp/product/				

本IFは2019年11月改訂（第3版）（ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「KN」・10mg「KN」）、2019年11月改訂（第3版）（ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」・10mg「KN」）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、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。

Ⅰ F 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(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>)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(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 判、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(PMDA)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(PMDA)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、薬機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、薬機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・一部変更)

目 次

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 1

II. 名称に関する項目

1. 販売名 2
 - (1) 和名 2
 - (2) 洋名 2
 - (3) 名称の由来 2
2. 一般名 2
 - (1) 和名 (命名法) 2
 - (2) 洋名 (命名法) 2
 - (3) ステム 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) 3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 3
7. CAS登録番号 3

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質 4
 - (1) 外観・性状 4
 - (2) 溶解性 4
 - (3) 吸湿性 4
 - (4) 融点(分解点)、沸点、凝固点 4
 - (5) 酸塩基解離定数 4
 - (6) 分配係数 4
 - (7) その他の主な示性値 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 4
3. 有効成分の確認試験法 4
4. 有効成分の定量法 4

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形 5
 - (1) 剤形の区別、外観及び性状 5
 - (2) 製剤の物性 5
 - (3) 識別コード 5
 - (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、
無菌の旨及び安定なpH域等 5
2. 製剤の組成 6
 - (1) 有効成分(活性成分)の含量 6
 - (2) 添加物 6
 - (3) その他 6
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 6
4. 製剤の各種条件下における安定性 6
5. 調製法及び溶解後の安定性 10
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化) 10
7. 溶出性 10
8. 生物学的試験法 18
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 19
10. 製剤中の有効成分の定量法 19
11. 力価 19
12. 混入する可能性のある夾雑物 19
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に
関する情報 19
14. その他 20

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果 21
2. 用法及び用量 21
3. 臨床成績 21
 - (1) 臨床データパッケージ 21
 - (2) 臨床効果 21

- (3) 臨床薬理試験 21
- (4) 探索的試験 21
- (5) 検証的試験 21
 - 1) 無作為化並行用量反応試験 21
 - 2) 比較試験 21
 - 3) 安全性試験 21
 - 4) 患者・病態別試験 22
- (6) 治療的使用 22
 - 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) 22
 - 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 22

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 23
2. 薬理作用 23
 - (1) 作用部位・作用機序 23
 - (2) 薬効を裏付ける試験成績 23
 - (3) 作用発現時間・持続時間 24

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法 25
 - (1) 治療上有効な血中濃度 25
 - (2) 最高血中濃度到達時間 25
 - (3) 臨床試験で確認された血中濃度 25
 - (4) 中毒域 27
 - (5) 食事・併用薬の影響 28
 - (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 28
2. 薬物速度論的パラメータ 28
 - (1) 解析方法 28
 - (2) 吸収速度定数 28
 - (3) バイオアベイラビリティ 28
 - (4) 消失速度定数 28
 - (5) クリアランス 28
 - (6) 分布容積 28
 - (7) 血漿蛋白結合率 28
3. 吸収 29
4. 分布 29
 - (1) 血液-脳関門通過性 29
 - (2) 血液-胎盤関門通過性 29
 - (3) 乳汁への移行性 29
 - (4) 髄液への移行性 29
 - (5) その他の組織への移行性 29
5. 代謝 29
 - (1) 代謝部位及び代謝経路 29
 - (2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の
分子種 29
 - (3) 初回通過効果の有無及びその割合 29
 - (4) 代謝物の活性の有無及び比率 29
 - (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ 29
6. 排泄 29
 - (1) 排泄部位及び経路 29
 - (2) 排泄率 30
 - (3) 排泄速度 30
7. トランスポーターに関する情報 30
8. 透析等による除去率 30

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 31
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む) 31

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意 とその理由	31	7. 容器の材質	36
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意 とその理由	31	8. 同一成分・同効薬	37
5. 慎重投与内容とその理由	31	9. 国際誕生年月日	37
6. 重要な基本的注意とその理由及び 処置方法	31	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	37
7. 相互作用	31	11. 薬価基準収載年月日	37
(1) 併用禁忌とその理由	31	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	37
(2) 併用注意とその理由	31	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	37
8. 副作用	32	14. 再審査期間	37
(1) 副作用の概要	32	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	37
(2) 重大な副作用と初期症状	32	16. 各種コード	38
(3) その他の副作用	32	17. 保険給付上の注意	38
(4) 項目別副作用発現頻度及び 臨床検査値異常一覧	32	X I. 文 献	
(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	32	1. 引用文献	39
(6) 薬物アレルギーに対する注意 及び試験法	32	2. その他の参考文献	39
9. 高齢者への投与	32	X II. 参考資料	
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	33	1. 主な外国での発売状況	40
11. 小児等への投与	33	2. 海外における臨床支援情報	40
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	33	X III. 備 考	
13. 過量投与	33	その他の関連資料	41
14. 適用上の注意	33		
15. その他の注意	33		
16. その他	33		
IX. 非臨床試験に関する項目			
1. 薬理試験	34		
(1) 薬効薬理試験 (「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)	34		
(2) 副次的薬理試験	34		
(3) 安全性薬理試験	34		
(4) その他の薬理試験	34		
2. 毒性試験	34		
(1) 単回投与毒性試験	34		
(2) 反復投与毒性試験	34		
(3) 生殖発生毒性試験	34		
(4) その他の特殊毒性	34		
X. 管理的事項に関する項目			
1. 規制区分	35		
2. 有効期間又は使用期限	35		
3. 貯法・保存条件	35		
4. 薬剤取扱い上の注意点	35		
(1) 薬局での取扱い上の留意点について	35		
(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)	35		
(3) 調剤時の留意点について	35		
5. 承認条件等	35		
6. 包装	36		

*

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、日本で発見され、2000 年にアレルギー性鼻炎を効能・効果として発売された。その後、2002 年に蕁麻疹、皮膚疾患に伴う瘙痒への効果が承認された。本剤は、第二世代抗ヒスタミン剤で、選択的ヒスタミン H₁ 受容体拮抗・アレルギー性治療薬の一つである。

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」、ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」は、小林化工(株)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 日付)に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法の設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2018 年(平成 30 年)2 月に承認を取得し、同年 6 月の薬価収載とともに発売に至った。ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」、ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」は、小林化工(株)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 日付)に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法の設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2018 年(平成 30 年)2 月に承認を取得し、同年 6 月に薬価収載され、同年 9 月に発売に至った。

<製造販売一部変更承認の履歴>

効能・効果、用法・用量追加：

小児に対する効能・効果、用法・用量追加(2019 年 11 月 20 日付承認)

<小児>

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚瘙痒症)に伴う瘙痒

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

①PTP シートの裏面に「アレルギー用薬」を記載している。

②副作用(頻度不明)

主な副作用として、眠気、口渇、悪心、嘔吐、胃痛、下痢、胃部不快感、倦怠感、蕁麻疹があらわれたとの報告がある。

<ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg・10mg「KN」>

・錠剤の表面に「ベポタ」の文字及び含量、裏面に「ベポタスチン」の文字及び含量を印刷した両面印刷錠である。

<ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg・10mg「KN」>

- ・直径約 7.1mm、厚さ約 2.6mm の錠剤。(錠 5mg のみ)
- ・錠剤の表面に「ベポタ OD」の文字及び含量、裏面に「ベポタスチン OD」の文字及び含量を印刷した両面印刷錠である。
- ・甘みを加えたメントール風味の口腔内崩壊錠。

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「KN」
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」

(2) 洋 名

BEPOTASTINE BESILATE Tablets 5mg「KN」
BEPOTASTINE BESILATE Tablets 10mg「KN」
BEPOTASTINE BESILATE OD Tablets 5mg「KN」
BEPOTASTINE BESILATE OD Tablets 10mg「KN」

(3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発0922001号」に基づき命名した。
一般名＋剤形＋規格含量＋「KN」
Kobayashi Kako Nippon

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）

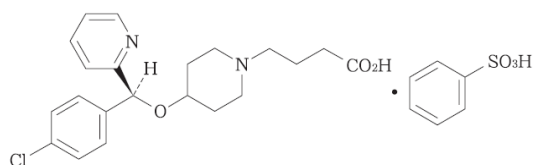
Bepotastine Besilate (JAN)
bepotastine (INN)

(3) ステム ¹⁾

抗ヒスタミン薬：-astine

3．構造式又は示性式

構造式：



4．分子式及び分子量

分子式：C₂₁H₂₅ClN₂O₃・C₆H₆O₃S

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

記号番号:KBEP（治験薬コード）

7. CAS 登録番号

190786-44-8 (Bepotastine Besilate)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状²⁾

白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性²⁾

各種溶媒における溶解度

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¹⁾

認められない。(25℃、33%RH～93%RH の保存条件で、1～14 日間にわたって検討したが、いずれの条件においても吸湿性は認められなかった。)

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点²⁾

融点：159～163℃

(5) 酸塩基解離定数¹⁾

$pK_1=3.81$ (吸光度法)、 $pK_2=4.23$ (滴定法)、 $pK_3=9.27$ (滴定法)

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値²⁾

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²⁾

(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

(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ベンゼンスルホン酸の確認

4. 有効成分の定量法²⁾

(日局ベポタスチンベシル酸塩の定量法による。)

本品約 0.8g を精密に量り、酢酸(100)60mL に溶かし、0.1mol/L 過塩素酸で滴定する(電位差滴定法)。同様の方法で空試験を行い、補正する。

0.1mol/L 過塩素酸 1mL=54.71mg $C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot C_6H_5O_3S$

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

製 品 名	有効成分の 名称・含量	性状	外 形		
			直 径	厚 さ	重 量
ベポタスチンベシル 酸塩錠5mg「KN」	1錠中、 日局ベポタスチン ベシル酸塩5mg 含有	白色のフィルムコーティ ング錠	 約6.1mm	 約2.7mm	—— 約84mg
ベポタスチンベシル 酸塩錠10mg「KN」	1錠中、 日局ベポタスチン ベシル酸塩10mg 含有	白色の割線入りのフィル ムコーティング錠	 約7.1mm	 約3.0mm	—— 約125mg
ベポタスチンベシル 酸塩OD錠5mg「KN」	1錠中、 日局ベポタスチン ベシル酸塩5mg 含有	白色の素錠 (口腔内崩壊錠)	 約7.1mm	 約2.6mm	—— 約125mg
ベポタスチンベシル 酸塩OD錠10mg「KN」	1錠中、 日局ベポタスチン ベシル酸塩10mg 含有	白色の割線入りの素錠 (口腔内崩壊錠)	 約9.1mm	 約3.4mm	—— 約250mg

(2) 製剤の物性

溶出性：「IV. 製剤に関する項目 7. 溶出性」の項参照

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」：

崩壊性：日本薬局方一般試験法 崩壊試験法 即放性製剤の項に適合する。

(3) 識別コード

製品名	薬物本体	
	表	裏
ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「KN」	ベポタ 5	ベポタスチン 5 KN
ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」	ベポタ 10	ベポタスチン 10 KN
ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」	ベポタ OD5	ベポタスチンOD 5 KN
ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」	ベポタ OD10	ベポタスチンOD 10 KN

(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「KN」：

1錠中、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「KN」：

1錠中、ベポタスチンベシル酸塩10mg含有

ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」：

1錠中、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OD錠10mg「KN」：

1錠中、ベポタスチンベシル酸塩10mg含有

(2) 添加物

製品名	添加物
ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「KN」	D-マンニトール、結晶セルロース、ヒプロメロース、ステアリン酸マグネシウム、タルク
ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」	
ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、スクラロース、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、香料、L-メントール、ステアリン酸マグネシウム
ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」	

(3) その他

該当資料なし

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³⁾

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」：

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目		結果	
						試験開始時	試験終了時
苛酷試験	25℃、75%RH	無包装品	3ヵ月	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質の最大(%)	0.007	0.009
					総類縁物質(%)	0.007	0.009
				溶出試験(%)		87.3～95.4	95.6～100.0
				定量試験(対表示量%)		97.9	97.5
	40℃		3ヵ月	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質の最大(%)	0.007	—
					総類縁物質(%)	0.007	—
				溶出試験(%)		87.3～95.4	100.2～104.5
				定量試験(対表示量%)		97.9	96.2

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目		結果	
						試験開始時	試験終了時
苛酷試験	蛍光灯照射 (1000lux)	無包装品	50日 (120万lux・hr)	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.007	—
					総類縁物質(%)	0.007	—
				溶出試験(%)		87.3～95.4	93.9～97.6
				定量試験(対表示量%)		97.9	96.0
加速試験	40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装品)	6ヵ月	性状・確認試験		*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験		*3	*3
				溶出試験(%)		96.0～106.1	94.8～107.2
				定量試験(対表示量%)		99.6～101.9	98.8～102.0
		性状・確認試験		*1、*2	*1、*2		
		製剤均一性試験		*3	*3		
		溶出試験(%)		96.0～106.1	94.9～107.5		
		定量試験(対表示量%)		99.6～101.9	98.8～101.7		
長期保存試験	25℃、60%RH	PTP包装品 (最終包装品)	42ヵ月	性状・確認試験		*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験		*3	*3
				溶出試験(%)		96.0～106.1	99.3～105.7
				定量試験(対表示量%)		99.6～101.9	99.1～102.3
		性状・確認試験		*1、*2	*1、*2		
		製剤均一性試験		*3	*3		
		溶出試験(%)		96.0～106.1	98.6～105.7		
		定量試験(対表示量%)		99.6～101.9	100.1～101.9		

*1：白色のフィルムコーティング錠であった。

*2：「IV. 製剤に関する項目 9. 製剤中の有効成分の確認試験法」に適合した。

*3：日局一般試験法 製剤均一性試験法 1. 含量均一性試験に適合した。

—：定量限界未満

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、60%RH、3年6ヵ月）の結果、ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」は通常の市場流通下において3年6ヵ月間安定であることが確認された。

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」：

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目		結果	
						試験開始時	試験終了時
苛酷試験	25℃、75%RH	無包装品	3ヵ月	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	—	—
					総類縁物質(%)	—	—
				溶出試験(%)		93.1～101.2	92.2～100.2
				定量試験(対表示量%)		99.3	98.9
	40℃		3ヵ月	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	—	—
					総類縁物質(%)	—	—
				溶出試験(%)		93.1～101.2	98.9～103.1
				定量試験(対表示量%)		99.3	99.7

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果		
					試験開始時	試験終了時	
苛酷試験	蛍光灯照射 (1000lux)	無包装品	50日 (120万lux・hr)	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	—	—
					総類縁物質(%)	—	—
				溶出試験(%)		93.1～101.2	97.3～102.9
				定量試験(対表示量%)		99.3	99.0
加速試験	40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装品)	6ヵ月	性状・確認試験		*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験		*3	*3
				溶出試験(%)		99.7～104.0	98.0～102.7
				定量試験(対表示量%)		98.0～100.6	99.6～101.9
		ポリエチレン製 容器入り包装品 (最終包装品)		性状・確認試験		*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験		*3	*3
				溶出試験(%)		99.7～104.0	97.3～103.4
				定量試験(対表示量%)		98.0～100.6	98.4～101.3
長期保存試験	25℃、60%RH	PTP包装品 (最終包装品)	42ヵ月	性状・確認試験		*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験		*3	*3
				溶出試験(%)		93.5～103.2	93.8～103.3
				定量試験(対表示量%)		98.4～103.2	98.7～100.1
		ポリエチレン製 容器入り包装品 (最終包装品)		性状・確認試験		*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験		*3	*3
				溶出試験(%)		93.5～103.2	95.9～103.5
				定量試験(対表示量%)		98.4～103.2	97.6～99.6

*1：白色の割線入りのフィルムコーティング錠であった。

*2：「IV. 製剤に関する項目 9. 製剤中の有効成分の確認試験法」に適合した。

*3：日局一般試験法 製剤均一性試験法 1. 含量均一性試験に適合した。

—：定量限界未満

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、60%RH、3年6ヵ月）の結果、ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」は通常の市場流通下において3年6ヵ月間安定であることが確認された。

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」：

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目		結果	
						試験開始時	試験終了時
苛酷試験	25℃、75%RH	無包装品	3ヵ月	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.01～0.05	0.04
					総類縁物質(%)	0.01～0.08	0.09
				崩壊試験(秒)		19～22	29
				溶出試験(%)		95.5～102.1	98.7～106.7
				定量試験(対表示量%)		102.2	102.3
	40℃		3ヵ月	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.01～0.05	0.04
					総類縁物質(%)	0.01～0.08	0.11
				崩壊試験(秒)		19～22	20～21
				溶出試験(%)		95.5～102.1	98.3～103.4
				定量試験(対表示量%)		102.2	100.5

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目		結果	
						試験開始時	試験終了時
苛酷試験	蛍光灯照射 (1000lux)	無包装品	50日 (120万lux・hr)	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.01～0.05	0.02
					総類縁物質(%)	0.01～0.08	0.03
				崩壊試験(秒)		19～22	20～21
				溶出試験(%)		95.5～102.1	93.5～103.3
				定量試験(対表示量%)		102.2	101.7
加速試験	40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装品)	6ヵ月	性状・確認試験		*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験		*3	*3
				崩壊試験(秒)		16～24	19～26
				溶出試験(%)		94.6～105.3	98.1～104.7
				定量試験(対表示量%)		100.4～101.8	100.4～102.2
		ポリエチレン製 容器入り包装品	6ヵ月	性状・確認試験		*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験		*3	*3
				崩壊試験(秒)		16～24	22～29
				溶出試験(%)		94.6～105.3	97.2～104.4
				定量試験(対表示量%)		100.4～101.8	100.6～102.4

*1：白色の素錠(口腔内崩壊錠)であった。

*2：「IV. 製剤に関する項目 9. 製剤中の有効成分の確認試験法」に適合した。

*3：日局一般試験法 製剤均一性試験法 1. 含量均一性試験に適合した。

－：定量限界未満

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、ベポタスチンベシル酸塩 OD錠 5mg「KN」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。

ベポタスチンベシル酸塩 OD錠 10mg「KN」：

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目		結果	
						試験開始時	試験終了時
苛酷試験	25℃、75%RH	無包装品	3ヵ月	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.01～0.03	0.01
					総類縁物質(%)		0.02～0.06
				崩壊試験(秒)		21～23	24～25
				溶出試験(%)		96.6～102.0	101.3～104.2
				定量試験(対表示量%)		101.4	102.5
	40℃		3ヵ月	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.01～0.03	0.01
					総類縁物質(%)		0.02～0.06
				崩壊試験(秒)		21～23	21
				溶出試験(%)		96.6～102.0	92.8～100.9
				定量試験(対表示量%)		101.4	103.6
	蛍光灯照射 (1000lux)		25日 (60万lux・hr)	性状		*1	*1
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.01～0.03	0.02
					総類縁物質(%)		0.02～0.06
				崩壊試験(秒)		21～23	22～23
				溶出試験(%)		96.6～102.0	92.0～102.5
				定量試験(対表示量%)		101.4	103.9

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果	
					試験開始時	試験終了時
加速試験	40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装品)	6ヵ月	性状・確認試験	*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験	*3	*3
				崩壊試験(秒)	19～26	21～29
				溶出試験(%)	93.2～104.4	94.5～104.0
				定量試験(対表示量%)	100.8～102.1	101.0～102.9
		ポリエチレン製 容器入り包装品 (最終包装品)	6ヵ月	性状・確認試験	*1、*2	*1、*2
				製剤均一性試験	*3	*3
				崩壊試験(秒)	19～26	26～33
				溶出試験(%)	93.2～104.4	95.0～103.7
				定量試験(対表示量%)	100.8～102.1	99.9～102.8

*1：白色の割線入りの素錠(口腔内崩壊錠)であった。

*2：「IV. 製剤に関する項目 9. 製剤中の有効成分の確認試験法」に適合した。

*3：日局一般試験法 製剤均一性試験法 1. 含量均一性試験に適合した。

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」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。

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⁴⁾

＜溶出挙動における類似性：生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験＞

ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「KN」：

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 医薬審第487号(平成9年12月22日付)、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 薬食審査発0229第10号(平成24年2月29日付)の別紙1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」及び別紙2「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」に準じる。

試験条件

試験方法：日本薬局方一般試験法 溶出試験法(パドル法)

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2 日局溶出試験 第1液

②pH5.0 薄めたMcIlvaineの緩衝液

③pH6.8 日局溶出試験 第2液

④水

回転数：50min⁻¹ 試験液①～④

100min⁻¹ 試験液③

判定基準

(1) 平均溶出率

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±10%の範囲にあるか、又はf2関数の値が50以上である。

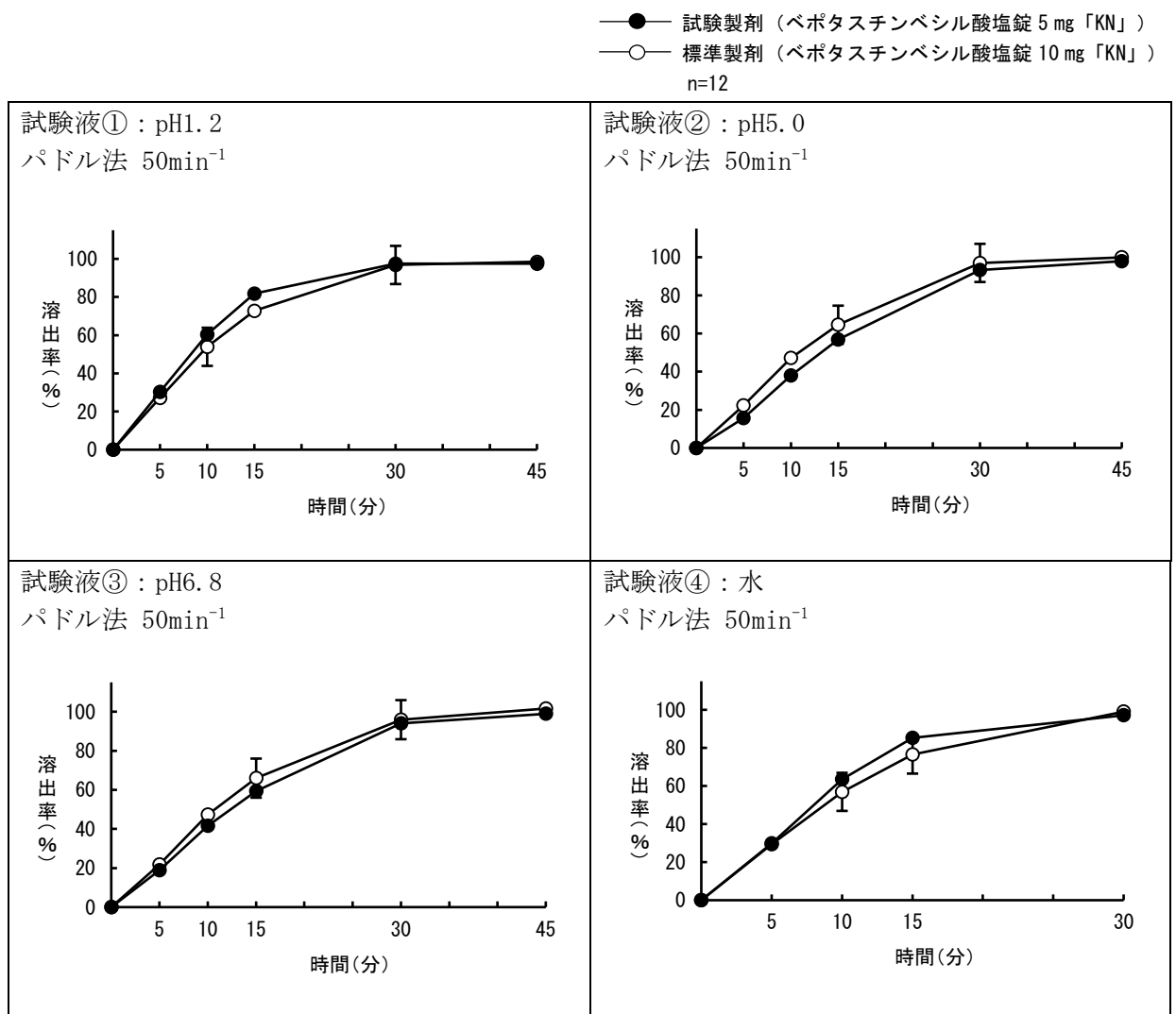
(2) 個々の溶出率

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがない。

試験結果

ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「KN」の溶出挙動は、ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、両剤の生物学的同等性が確認された。

図1 ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「KN」の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)



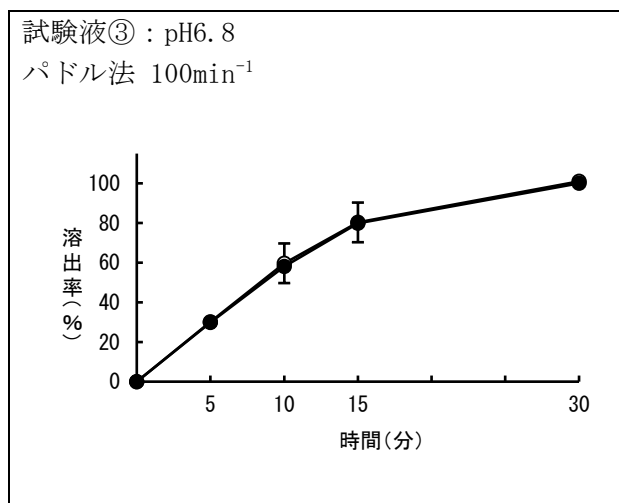


表1 ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「KN」の溶出挙動における同等性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験製剤 (ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」)	標準製剤 (ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率(%)	平均溶出率(%)	
パドル法	50min ⁻¹	①pH1.2	10 分	60.4	53.9	適合
			30 分	97.5	96.8	
		②pH5.0	15 分	56.8	64.6	適合
			30 分	93.2	97.0	
		③pH6.8	15 分	59.4	66.0	適合
			30 分	94.0	95.9	
		④水	10 分	63.5	56.9	適合
			15 分	85.3	76.5	
	100min ⁻¹	③pH6.8	10 分	58.1	59.7	適合
			15 分	79.8	80.3	

(n=12)

(試験製剤の個々の溶出率の比較)

試験条件				ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「KN」		判定
方法	回転数	試験液	判定時点	個々の溶出率(%)	平均溶出率±S.D.(%)	
パドル法	50min ⁻¹	①pH1.2	30分	98.8、96.2、98.6、96.8、95.7、93.3、98.3、98.0、98.3、100.1、98.5、97.1	97.5±1.79	適合
		②pH5.0	30分	88.5、86.3、95.0、94.4、99.1、95.9、91.6、95.4、96.1、98.2、82.2、95.9	93.2±5.10	適合
		③pH6.8	30分	98.6、99.0、96.4、85.3、95.1、96.6、95.3、83.3、98.5、98.5、90.6、90.4	94.0±5.37	適合
		④水	15分	82.2、93.2、80.2、87.7、86.7、83.0、84.3、86.2、84.6、85.5、87.3、82.8	85.3±3.35	適合
	100min ⁻¹	③pH6.8	15分	79.0、82.7、80.4、93.5、83.2、101.1、74.1、72.1、74.7、77.6、68.8、70.0	79.8±9.54	適合

(n=12)

ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」：

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 医薬審第487号（平成9年12月22日付）、
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 薬食審査発0229
第10号（平成24年2月29日付）の別紙1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」
に準じる。

試験条件

試験方法：日本薬局方一般試験法 溶出試験法（パドル法）

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2 日局溶出試験 第1液

②pH3.0 薄めたMcIlvaineの緩衝液

③pH6.8 日局溶出試験 第2液

④水

回転数：50min⁻¹ 試験液①～④

100min⁻¹ 試験液①

判定基準

試験液①(50min⁻¹)

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 関数の値が 42 以上である。

試験液①(100min⁻¹)、②、③、④

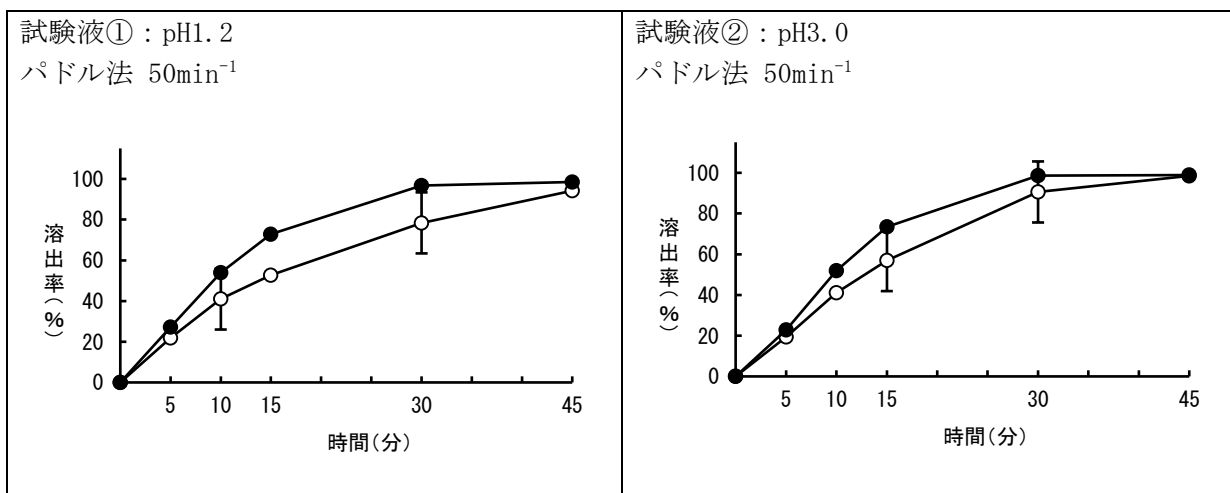
標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。

試験結果

ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」の溶出挙動は、各試験液において標準製剤と類似していることが確認された。

図2 ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」の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)

● 試験製剤（ベポタスチンベシル酸塩錠 10 mg「KN」）
○ 標準製剤（錠剤、10mg）
n=12



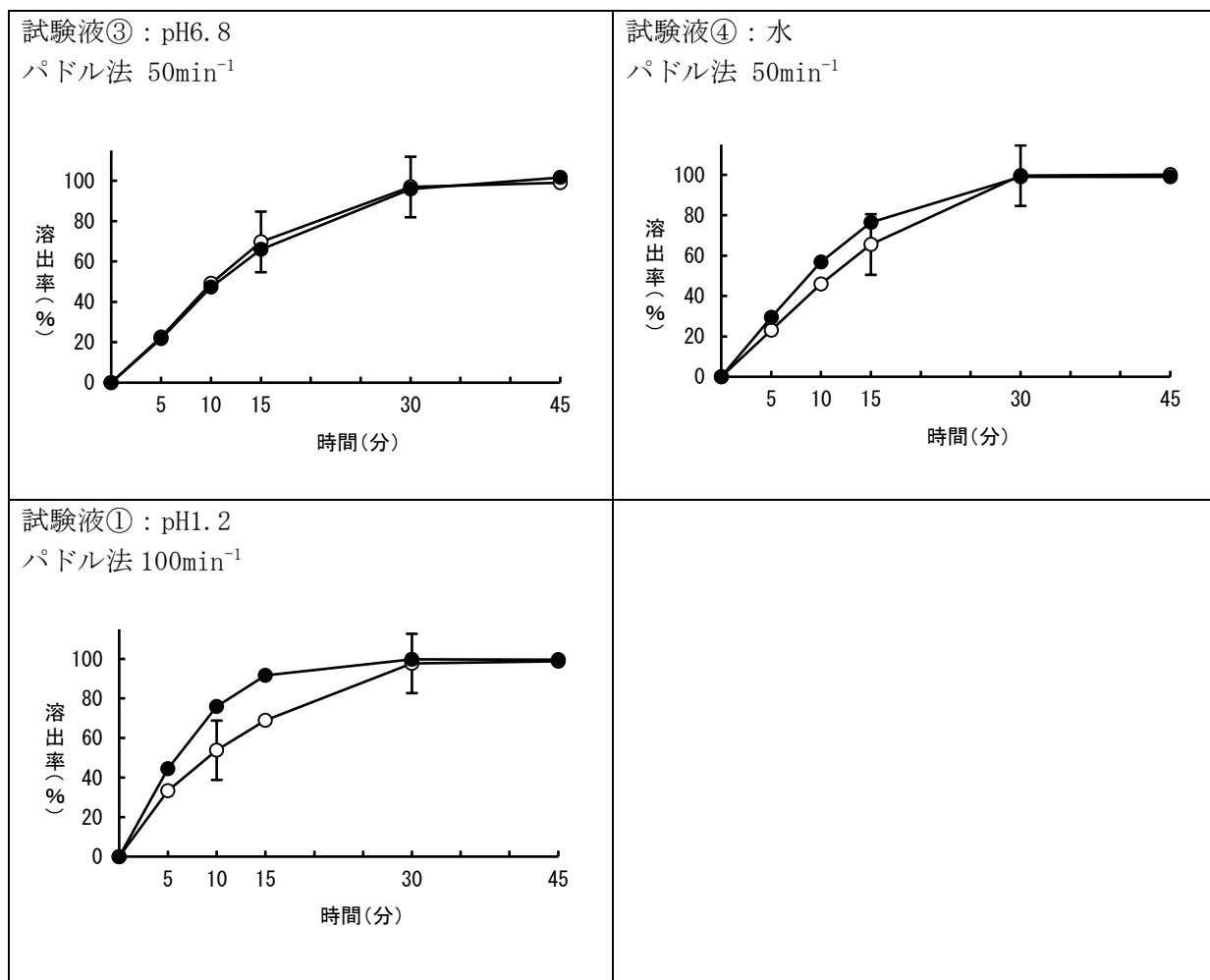


表2 ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」の溶出挙動における類似性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験製剤 (ベポタスチンベシル酸塩錠 10 mg「KN」)	標準製剤 (錠剤、10mg)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
パドル法	50min ⁻¹	①pH1.2	10 分	53.9	41.0	不適※1
			30 分	96.8	78.4	
			f2 関数	38.1		
		②pH3.0	15 分	73.5	56.9	適合※2
			30 分	98.6	90.6	
			f2 関数	48.5		
		③pH6.8	15 分	66.0	69.7	適合
			30 分	95.9	96.9	
		④水	15 分	76.5	65.5	適合
	30 分		99.0	99.6		
	100min ⁻¹	①pH1.2	10 分	75.9	53.8	適合※2
			30 分	99.8	97.7	
f2 関数			44.0			

(n=12)

※1：試験製剤の平均溶出率は、標準製剤との間の溶出挙動の類似性基準に適合しなかったが、後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインにおける「著しい差」ではなかった。

著しい差：溶出の速い方の製剤の平均溶出率が80%に達した時点で他方の製剤の平均溶出率が50%以下となるとき。また、溶出の速い方の製剤の平均溶出率が15分で85%以上であるときに、溶出の遅い方の製剤の平均溶出率がもう一方の製剤の平均溶出率に対して60%以下であるとき。

※2：判定が不適であったことにより、f2関数で判定したところ適合であった。

ベポタスチンベシル酸塩0D錠5mg「KN」：

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 医薬審第487号（平成9年12月22日付）、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 薬食審査発0229第10号（平成24年2月29日付）の別紙1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」及び別紙2「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」に準じる。

試験条件

試験方法：日本薬局方一般試験法 溶出試験法（パドル法）

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2 日局溶出試験 第1液

②pH4.0 薄めたMcIlvaineの緩衝液

③pH6.8 日局溶出試験 第2液

④水

回転数：50min⁻¹

判定基準

(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

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、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

ベポタスチンベシル酸塩0D錠5mg「KN」の溶出挙動は、ベポタスチンベシル酸塩0D錠10mg「KN」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、両剤の生物学的同等性が確認された。

図3 ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」の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)

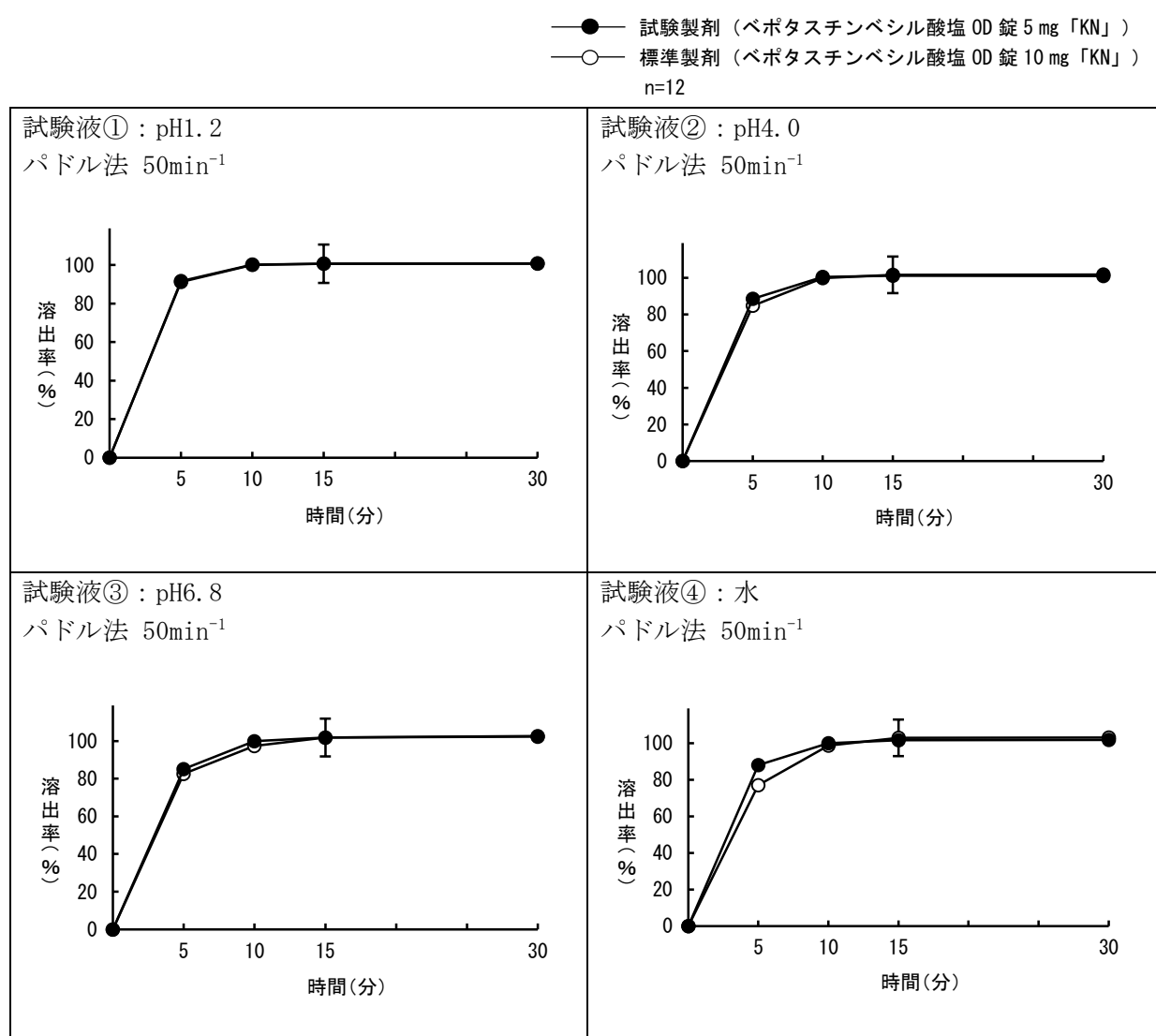


表3 ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」の溶出挙動における同等性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験製剤 (ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」)	標準製剤 (ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率(%)	平均溶出率(%)	
パドル法	50min ⁻¹	①pH1.2	15 分	100.7	100.7	適合
		②pH4.0	15 分	101.2	101.7	適合
		③pH6.8	15 分	101.9	101.9	適合
		④水	15 分	101.6	102.9	適合

(n=12)

(試験製剤の個々の溶出率の比較)

試験条件				ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg 「KN」		判定
方法	回転数	試験液	判定時点	個々の溶出率(%)	平均溶出率±S.D.(%)	
パドル法	50min ⁻¹	①pH1.2	15分	102.1、102.4、104.4、101.2、98.9、101.1、98.4、100.6、100.4、100.3、98.1、100.5	100.7±1.77	適合
		②pH4.0	15分	100.0、100.1、101.2、102.8、102.4、100.1、99.3、102.2、100.4、103.1、99.8、103.5	101.2±1.48	適合
		③pH6.8	15分	102.6、103.6、104.1、101.3、103.5、96.8、101.3、101.6、101.8、100.7、100.8、104.4	101.9±2.06	適合
		④水	15分	103.4、100.7、102.4、101.8、100.4、101.2、102.8、101.7、99.8、100.3、102.6、101.7	101.6±1.12	適合

(n=12)

ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg 「KN」：

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 医薬審第487号（平成9年12月22日付）、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 薬食審査発0229第10号（平成24年2月29日付）の別紙1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に準じる。

試験条件

試験方法：日本薬局方一般試験法 溶出試験法（パドル法）

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2 日局溶出試験 第1液

②pH4.0 薄めたMcIlvaineの緩衝液

③pH6.8 日局溶出試験 第2液

④水

回転数：50min⁻¹

判定基準

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。

試験結果

ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg 「KN」の溶出挙動は、各試験液において標準製剤と類似していることが確認された。

図4 ペポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」の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)

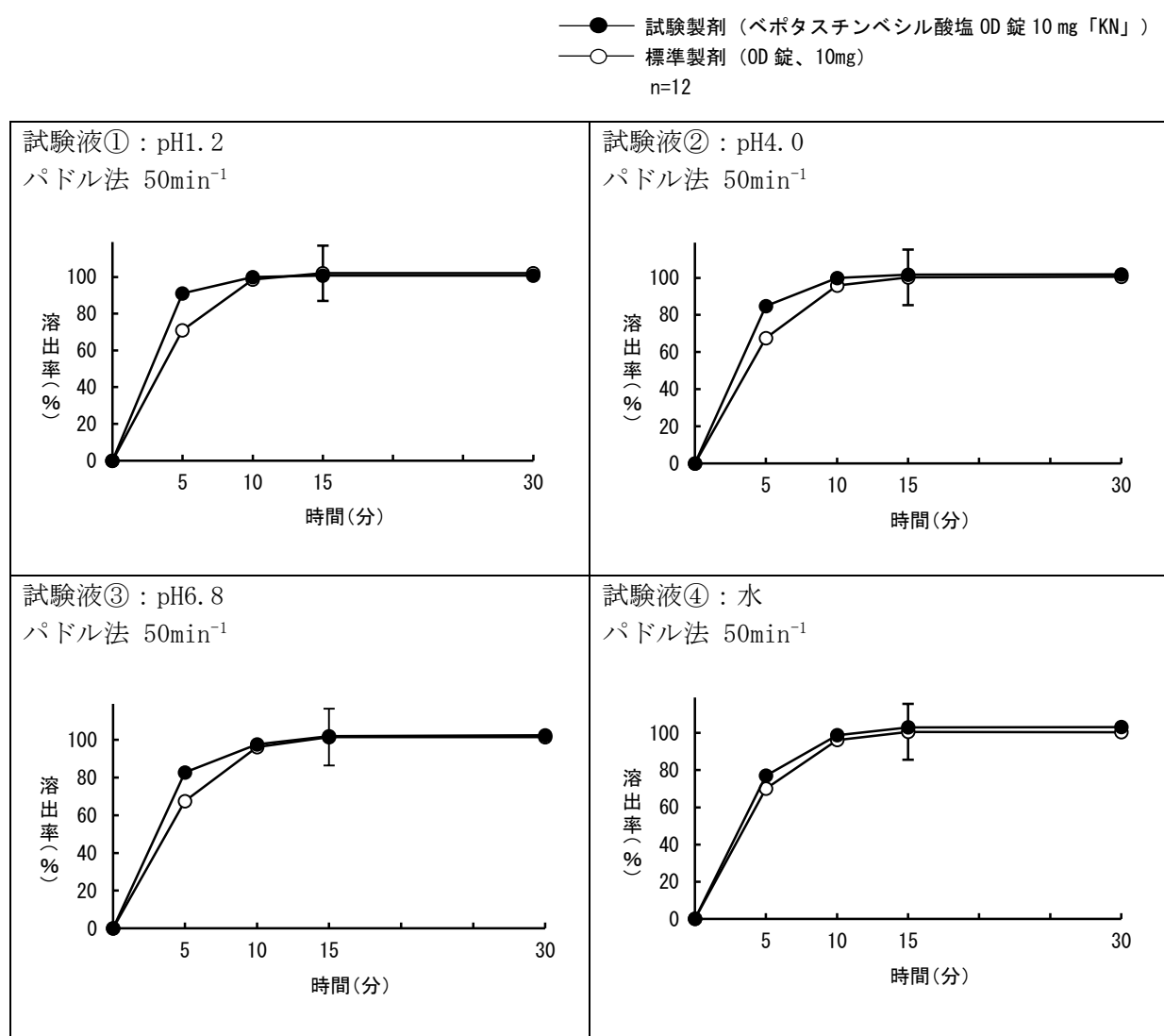


表4 ペポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」の溶出挙動における類似性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験製剤 (ペポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10 mg「KN」)	標準製剤 (OD 錠、10mg)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
パドル法	50min ⁻¹	①pH1.2	15 分	100.7	102.0	適合
		②pH4.0	15 分	101.7	100.2	適合
		③pH6.8	15 分	101.9	101.4	適合
		④水	15 分	102.9	100.6	適合

(n=12)

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

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」：

(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

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」：

(1) ライネッケ塩試液による沈殿反応

(2) 紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」：

(日局ベポタスチンベシル酸塩錠の定量法による。)

本品 20 個以上をとり、その質量を精密に量り、粉末とする。ベポタスチンベシル酸塩 ($C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot C_6H_6O_3S$) 約 10mg に対応する量を精密に量り、内標準溶液 5mL を正確に加え、移動相 20mL を加えて 10 分間激しく振り混ぜた後、孔径 $0.45 \mu m$ 以下のメンブランフィルターでろ過する。初めのろ液 5mL を除き、次のろ液 2mL を量り、移動相を加えて 10mL とし、試料溶液とする。別に定量用ベポタスチンベシル酸塩(別途「ベポタスチンベシル酸塩」と同様の方法で水分及び残留溶媒を測定しておく)約 20mg を精密に量り、内標準溶液 10mL を正確に加えた後、移動相を加えて溶かし、50mL とする。この液 2mL を量り、移動相を加えて 10mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 $20 \mu L$ につき、液体クロマトグラフィーにより試験を行い、内標準物質のピーク面積に対するベポタスチンのピーク面積の比 Q_T 及び Q_S を求める。

$$\text{ベポタスチンベシル酸塩 } (C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot C_6H_6O_3S) \text{ の量 (mg)} = M_S \times \frac{Q_T}{Q_S} \times \frac{1}{2}$$

M_S ：脱水及び脱溶媒物に換算した定量用ベポタスチンベシル酸塩の秤取量 (mg)

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」：

液体クロマトグラフィー

内標準溶液：パラオキシ安息香酸エチルの移動相溶液 (1→50000)

検出器：紫外吸光光度計

測定波長：262nm

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、皮膚瘙痒症)

＜小児＞

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚瘙痒症)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。

(OD錠のみ)

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

本剤は口腔内で速やかに崩壊することから唾液のみ(水なし)でも服用可能であるが、口腔粘膜からの吸収により効果発現を期待する製剤ではないため、崩壊後は唾液又は水で飲み込むこと。

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⁵⁾

抗ヒスタミン薬：ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ホモクロルシクリジン塩酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、トリプロリジン塩酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、オロパタジン塩酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、ロラタジン

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序²⁾

抗アレルギー薬。ヒスタミン H_1 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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

以下の報告がある。⁶⁾

① ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用

ヒスタミン H_1 受容体に対して選択的親和性を示し、5HT₂、 α_1 、 α_2 、muscarine 受容体に対しては親和性を示さなかった。

ヒスタミンによる皮膚血管透過性亢進を 0.1mg/kg（ラット）、0.03mg/kg（モルモット）の経口投与で抑制し、ヒスタミンによる気道狭窄（麻酔イヌ）を 10 μ g/kg の十二指腸内投与で抑制した。また、モルモットの摘出平滑筋（気管支、回腸）のヒスタミンによる収縮を抑制した。

② I 型アレルギー反応抑制作用

I 型アレルギー反応モデルである受身皮膚アナフィラキシー（PCA）反応（ラット、モルモット）をそれぞれ 0.3mg/kg、1mg/kg の経口投与で抑制し、また、抗原により誘発される気道狭窄およびアナフィラキシー性ショック（モルモット）を 0.3mg/kg の経口投与で抑制した。

感作モルモットに抗原を点鼻することにより誘発される二相性の鼻腔抵抗上昇に対し 1～3mg/kg の経口投与で即時相を、3～10mg/kg の経口投与で遅発相を抑制した。また、ラットにおいて抗原誘発鼻粘膜血管透過性亢進を 1～10mg/kg の経口投与で抑制した。

③ 好酸球に対する作用

感作モルモットにおいて抗原吸入気道内好酸球浸潤を 1mg/kg の経口投与で、感作マウスにおいては抗原吸入による気道内好酸球浸潤と末梢血好酸球増多を 10mg/kg の反復経口投与により抑制した。また、血小板活性化因子（PAF）吸入による気道内好酸球浸潤（モルモット）および胸腔内投与による胸腔内好酸球浸潤（ラット）を、それぞれ 1mg/kg、10mg/kg の経口投与により抑制した。

④ サイトカイン産生に対する作用

ヒト末梢単核球におけるインターロイキン-5 の産生を 10^{-5} M で抑制し、その作用はプレインキュベーションすることにより 10^{-7} M でも発現した。

⑤その他の薬理作用(催不整脈作用)

麻酔イヌを用いた試験において、テルフェナジンは 3mg/kg以上の静脈内投与で心電図 QTc 間隔の延長作用を示したが、ベポタスチンでは 10mg/kgの静脈内投与でも心電図 QTc 間隔に有意な影響を与えなかった。

また、モルモット単離心筋細胞における K 電流に対して、テルフェナジンは 10 μ M の濃度で K 電流を抑制したが、ベポタスチンは 10 μ M の濃度で影響を与えなかった。

(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⁷⁾

製品名	投与量	t _{max} (h)
ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」	10mg	1.2±0.5

(Mean±S. D.、n=8)

製品名		投与量	t _{max} (h)
ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」	水あり	10mg	0.9±0.3
	水なし	10mg	1.2±0.3

(Mean±S. D.、n=20)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁷⁾

＜生物学的同等性試験＞

ベポタスチンベシル酸塩錠 5 mg 「KN」：

ベポタスチンベシル酸塩錠 5 mg 「KN」 は「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 24 年 2 月 29 日付)薬食審査発第 0229 第 10 号」の別紙 1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」及び別紙 2「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」に基づき、ベポタスチンベシル酸塩錠 10 mg 「KN」を標準製剤とした溶出試験の結果、溶出挙動は同等と判定され、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 「KN」：

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 医薬審第 487 号(平成 9 年 12 月 22 日付)、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 薬食審査発第 0229 第 10 号(平成 24 年 2 月 29 日付)の別紙 1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に準じる。

ベポタスチンベシル酸塩錠 10 mg 「KN」と標準製剤それぞれ 1 錠(ベポタスチンベシル酸塩 10mg)を、2 剤 2 期のクロスオーバー法により健康成人男性に水 150mL とともに絶食単回経口投与した。第 I 期と第 II 期の休薬期間は 7 日間とした。血漿中未変化体濃度は、投与前 1 回、投与後 0.5、1、1.5、2、3、4、6、8 及び 10 時間目の計 10 時点に採血を行い、LC/MS/MS 法にて測定し、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(図 5、表 5)。

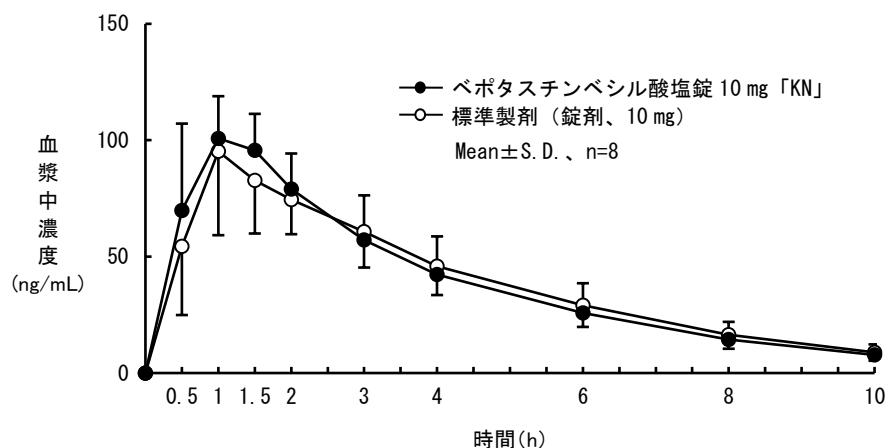


図 5 ベポタスチンの血漿中濃度推移

表 5 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→10h} (ng・h/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (h)	t _{1/2} (h)
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」	401.26±50.77	109.19±14.51	1.2±0.5	2.4±0.2
標準製剤（錠剤、10mg）	401.49±57.32	105.78±21.20	1.4±0.7	2.5±0.3

(Mean±S. D.、n=8)

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。

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5 mg 「KN」：

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5 mg 「KN」は「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 24 年 2 月 29 日付)薬食審査発第 0229 第 10 号」の別紙 1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」及び別紙 2「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」に基づき、ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10 mg 「KN」を標準製剤とした溶出試験の結果、溶出挙動は同等と判定され、生物学的に同等とみなされた。

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg 「KN」：

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 医薬審第 487 号(平成 9 年 12 月 22 日付)、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 薬食審査発第 0229 第 10 号(平成 24 年 2 月 29 日付)の別紙 1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に準じる。

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10 mg 「KN」と標準製剤それぞれ 1 錠(ベポタスチンベシル酸塩 10 mg)を、2 剤 2 期のクロスオーバー法により健康成人男性に水あり及び水なしで絶食単回経口投与した。第 I 期と第 II 期の休薬期間は 7 日間とした。血漿中未変化体濃度は、投与前 1 回、投与後 0.5、1、1.5、2、3、4、6、8 及び 10 時間目の計 10 時点に採血を行い、LC/MS/MS 法にて測定し、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(図 6、図 7、表 6)。

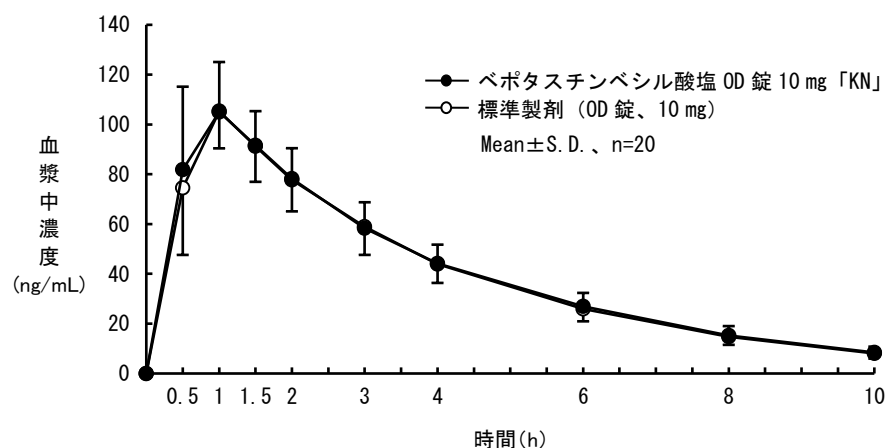


図 6 ペポタスチンの血漿中濃度推移(水あり)

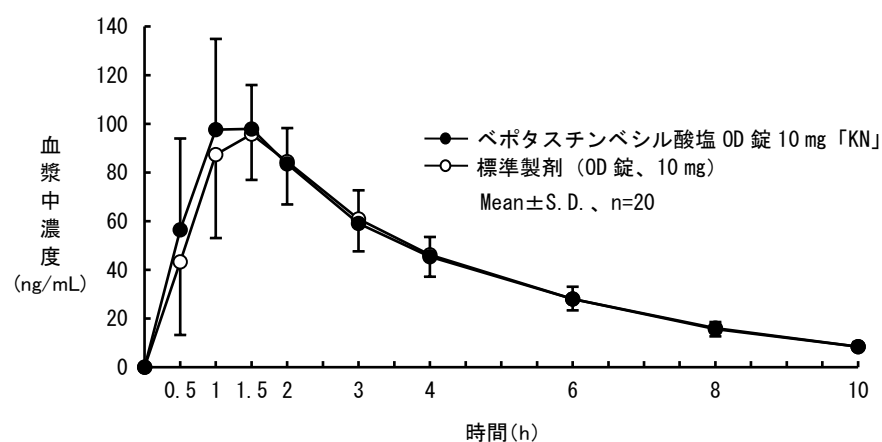


図 7 ペポタスチンの血漿中濃度推移(水なし)

表 6 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→10h} (ng・h/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (h)	t1/2 (h)
水あり	ペポタスチンベシル酸塩OD錠 10mg「KN」	415.22 ± 46.86	110.11 ± 14.14	0.9 ± 0.3	2.5 ± 0.3
	標準製剤 (OD錠、10mg)	408.03 ± 52.22	110.71 ± 16.25	1.0 ± 0.3	2.4 ± 0.3
水なし	ペポタスチンベシル酸塩OD錠 10mg「KN」	412.28 ± 49.55	110.68 ± 24.08	1.2 ± 0.3	2.5 ± 0.3
	標準製剤 (OD錠、10mg)	402.66 ± 36.05	105.52 ± 17.41	1.2 ± 0.3	2.4 ± 0.2

(Mean ± S. D.、n=20)

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

以下の報告がある。⁶⁾

食事の影響：

ベポタスチンベシル酸塩製剤20mgを空腹時および食後投与し、未変化体の血漿中濃度および24時間の累積尿中排泄量を測定したが、いずれも食事による影響は認められなかった。

※本剤の承認された用法・用量は、ベポタスチンベシル酸塩として1回10mgを1日2回経口投与である。

(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

Moment 法

(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⁷⁾

製品名		投与量	K_{el} (h^{-1})
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」		10mg	0.2902 ± 0.03046

(Mean $\pm$ S. D.、n=8)

製品名		投与量	K_{el} (h^{-1})
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」	水あり	10mg	0.2816 ± 0.03354
	水なし	10mg	0.2827 ± 0.03315

(Mean $\pm$ S. D.、n=20)

(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

該当資料なし

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%であったとの報告がある。²⁾

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. 妊婦、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

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との報告がある。²⁾

(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

該当資料なし

以下の報告がある。²⁾

主に尿中に排泄される。

(2) 排泄率

該当資料なし

以下の報告がある。²⁾

投与後 24 時間までに投与量に対して 76.4～87.9%が尿中に排泄された。また、20mg を 1 日 2 回 7 日間反復経口投与した場合も尿中排泄率は 80.7%と単回投与時とほぼ一致した。

(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

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」：

「V. 治療に関する項目 2. 用法及び用量」の項参照。

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。
- (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)、ALT (GPT)、 γ -GTP の上昇、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

【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

その他の副作用

	頻 度 不 明
過敏症	発疹、腫脹、蕁麻疹

9. 高齢者への投与

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

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

小児等への投与⁸⁾

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)。

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

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」：

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。]

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」：

適用上の注意

- (1) 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。]
- (2) 服用時：
- 1) 本剤は舌の上のにせ唾液を浸潤させると唾液のみで崩壊するので、水なしで服用することが可能である。また、水で服用することも可能である。
 - 2) 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用しないこと。

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「KN」	該当しない
ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「KN」	該当しない
ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」	該当しない
ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」	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

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」：
使用期限：3 年 6 ヶ月（外箱等に表示）（安定性試験結果に基づく）
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」：
使用期限：3 年（外箱等に表示）（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

貯法：気密容器、室温保存

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. 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

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。

- ・くすりのしおり：有り
- ・患者向医薬品ガイド：有り

(3) 調剤時の留意点について

- ・普通錠及びOD錠共に、5mgと10mgの2規格があり、規格毎にPTPシートの色が異なっている。

5. 承認条件等

【承認条件】

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

本剤の「医薬品リスク管理計画」は下記 URL に掲載されている。

「独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ「RMP 提出品目一覧」」

<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/items-information/rmp/0001.html>

6. 包装

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」：

PTP ：100 錠(10 錠×10 シート)

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」：

PTP ：100 錠(10 錠×10 シート)、140 錠(14 錠×10 シート)、500 錠(10 錠×50 シート)

バラ：100 錠

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」：

PTP ：100 錠(10 錠×10 シート)

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」：

PTP ：100 錠(10 錠×10 シート)、140 錠(14 錠×10 シート)、500 錠(10 錠×50 シート)

バラ：100 錠

7. 容器の材質

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」：

PTP 包装

シート：ポリ塩化ビニル(PVC)、金属

ピロー：ポリエチレン(PE)、金属

箱：紙

バラ包装

キャップ：ポリプロピレン(PP)

パッキン：ポリエチレン(PE)

ボトル：ポリエチレン(PE)

ラベル：ポリプロピレン(PP)

詰め物：ポリエチレン(PE)

乾燥剤

箱：紙

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」・ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」：

PTP 包装

シート：環状オレフィンコポリマー(COC)、ポリプロピレン(PP)、金属

ピロー：ポリエチレン(PE)、金属

乾燥剤

箱：紙

バラ包装

キャップ：ポリプロピレン(PP)

パッキン：ポリエチレン(PE)

ボトル：ポリエチレン(PE)

ラベル：ポリプロピレン(PP)

詰め物：ポリエチレン(PE)

乾燥剤

箱：紙

8. 同一成分・同効薬

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

同 効 薬：ロラタジン、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などのヒスタミン_{H1}受容体拮抗剤

9. 国際誕生年月日¹⁾

2000 年 7 月

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	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「KN」	2018 年 2 月 15 日	23000AMX00432000
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」	2018 年 2 月 15 日	23000AMX00431000
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」	2018 年 2 月 15 日	23000AMX00430000
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」	2018 年 2 月 15 日	23000AMX00429000

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」	2018 年 6 月 15 日
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」	2018 年 6 月 15 日
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」	2018 年 6 月 15 日
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」	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

効能・効果、用法・用量追加：

小児に対する効能・効果及び用法・用量（2019 年 11 月 20 日付承認）

＜小児＞

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症）に伴う掻痒

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

製品名	包装	HOT(13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「KN」	100 錠 (PTP)	1264548010101	4490022F1070	622645401
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」	100 錠 (PTP)	1264555010101	4490022F2077	622645501
	140 錠 (PTP)	1264555010201		
	500 錠 (PTP)	1264555010102		
	100 錠 (ﾊﾞﾗ)	1264555010301		
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」	100 錠 (PTP)	1264579010101	4490022F3049	622645701
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」	100 錠 (PTP)	1264586010101	4490022F4045	622645801
	140 錠 (PTP)	1264586010201		
	500 錠 (PTP)	1264586010102		
	100 錠 (ﾊﾞﾗ)	1264586010301		

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) 公益財団法人 日本薬剤師研修センター編：第十七改正日本薬局方医薬品情報 JPDI 2016
- 2) 第十七改正日本薬局方解説書
- 3) 小林化工株式会社・社内資料(安定性試験)
- 4) 小林化工株式会社・社内資料(溶出試験)
- 5) 薬剤分類情報閲覧システム<<http://www.iryohoken.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>
(2019/8/5 アクセス)
- 6) 日本薬剤師研修センター編：医薬品服薬指導情報集[薬効別]追補版 2
- 7) 小林化工株式会社・社内資料(生物学的同等性試験)
- 8) 馬場駿吉：臨床医薬、18(12)、(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

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XⅢ. 備 考

その他の関連資料

- ・製品情報URL

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「KN」:

<https://www.kobayashikako.co.jp/product/detail.php?prodcid=17194>

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「KN」:

<https://www.kobayashikako.co.jp/product/detail.php?prodcid=17196>

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「KN」:

<https://www.kobayashikako.co.jp/product/detail.php?prodcid=17197>

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「KN」:

<https://www.kobayashikako.co.jp/product/detail.php?prodcid=17198>

製造販売元



小林化工株式会社

〒919-0603 福井県あわら市矢地5-15