

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2018(2019年更新版)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「サワイ」

ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」

ベポタスチンベシル酸塩口腔内崩壊錠

ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「サワイ」

ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」

BEPOTASTINE BESILATE Tablets, OD Tablets [SAWAI]

剤形	錠5mg：フィルムコーティング錠 錠10mg：割線入りフィルムコーティング錠 OD錠5mg：素錠(口腔内崩壊錠) OD錠10mg：割線入り素錠(口腔内崩壊錠)
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠5mg/OD錠5mg：1錠中日局ベポタスチンベシル酸塩5mg含有 錠10mg/OD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 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2018年2月15日 薬価基準収載年月日：2018年6月15日 販売開始年月日：2018年6月15日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2024年3月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム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)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り、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020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	31
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	31
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	31
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	31
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	31
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	31
6. RMPの概要	1	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	31
II. 名称に関する項目	2	7. 相互作用	32
1. 販売名	2	8. 副作用	32
2. 一般名	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	33
3. 構造式又は示性式	2	10. 過量投与	33
4. 分子式及び分子量	2	11. 適用上の注意	33
5. 化学名(命名法)又は本質	2	12. その他の注意	33
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	IX. 非臨床試験に関する項目	34
III. 有効成分に関する項目	4	1. 薬理試験	34
1. 物理化学的性質	4	2. 毒性試験	34
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	X. 管理的事項に関する項目	35
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	1. 規制区分	35
IV. 製剤に関する項目	6	2. 有効期間	35
1. 剤形	6	3. 包装状態での貯法	35
2. 製剤の組成	7	4. 取扱い上の注意	35
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	5. 患者向け資材	35
4. 力価	7	6. 同一成分・同効薬	35
5. 混入する可能性のある夾雑物	7	7. 国際誕生年月日	35
6. 製剤の各種条件下における安定性	8	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	36
7. 調製法及び溶解後の安定性	12	9. 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	36
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	12	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	36
9. 溶出性	12	11. 再審査期間	36
10. 容器・包装	16	12. 投薬期間制限に関する情報	36
11. 別途提供される資材類	17	13. 各種コード	36
12. その他	18	14. 保険給付上の注意	36
V. 治療に関する項目	19	XI. 文献	37
1. 効能又は効果	19	1. 引用文献	37
2. 効能又は効果に関連する注意	19	2. その他の参考文献	39
3. 用法及び用量	19	XII. 参考資料	40
4. 用法及び用量に関連する注意	19	1. 主な外国での発売状況	40
5. 臨床成績	19	2. 海外における臨床支援情報	40
VI. 薬効薬理に関する項目	23	XIII. 備考	41
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	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	41
2. 薬理作用	23	2. その他の関連資料	43
VII. 薬物動態に関する項目	25		
1. 血中濃度の推移	25		
2. 薬物速度論的パラメータ	28		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	28		
4. 吸収	28		
5. 分布	29		
6. 代謝	29		
7. 排泄	29		
8. トランスポーターに関する情報	30		
9. 透析等による除去率	30		
10. 特定の背景を有する患者	30		
11. その他	30		

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 5 mg/錠10mg/OD錠 5 mg/OD錠10mg「サワイ」は、日局ベポタスチンベシル酸塩を含有する選択的ヒスタミンH₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2018年2月
上市	2018年6月

2019年11月に小児に対する「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」の効能又は効果が追加承認された。(X. -9. 参照)

2. 製品の治療学的特性

- 1) 本剤の用法は、「1日2回投与」である。(V. -3. 参照)
- 2) 血管透過性亢進及び平滑筋収縮に関与するヒスタミンに対する拮抗作用、ならびに好酸球機能の活性化に関与するインターロイキン-5の産生抑制作用と考えられる¹⁾。(VI. -2. 参照)
- 3) 副作用として、眠気、口渇、悪心等が報告されている。(VIII. -8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

特になし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2024年11月1日時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

1) 承認条件

該当しない

2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

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

2) 洋名

BEPOTASTINE BESILATE Tablets, OD Tablets [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

ベポタスチンベシル酸塩(JAN)

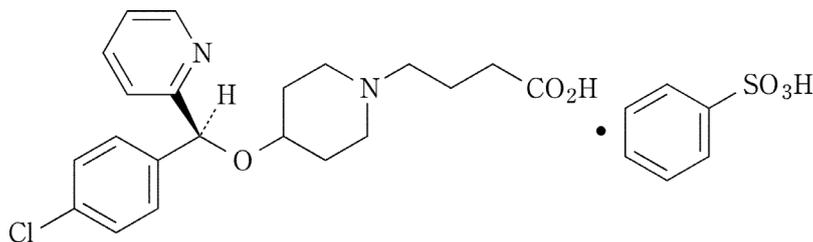
2) 洋名(命名法)

Bepotastine Besilate(JAN)
Bepotastine(INN)

3) ステム(stem)

-astine : antihistaminics

3. 構造式又は示性式



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)又は本質

(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

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

水分：0.1%以下(0.3g、電量滴定法)

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：159～163℃

5) 酸塩基解離定数

pK₁：3.81(吸光度法)、pK₂：4.23(滴定法)、pK₃：9.27(滴定法)²⁾

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

pH：本品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

貯法：気密容器

原薬の安定性²⁾

水：該当資料なし

液性(pH)：該当資料なし

光：

試験の種類	保存方法	保存形態	保存期間	結果	
苛酷試験	光	白色蛍光灯	シャーレ(ポリ塩化ビニリデンフィルムで覆う)	120万lx・hr	変化なし
		近紫外蛍光灯	シャーレ(ポリ塩化ビニリデンフィルムで覆う)	150W・hr/m ²	変化なし

測定項目：性状、確認試験、旋光度、融点、純度試験、乾燥減量、

HPLC法によるベポタスチンベシル酸塩の定量、光学異性体の定量、含量

その他：

試験の種類	保存方法	保存形態	保存期間	結果	
長期保存試験	25℃, 60%RH	ガラス瓶(開栓)	3年	変化なし	
加速試験	40℃, 75%RH	ガラス瓶(開栓)	6ヵ月	変化なし	
苛酷試験	温度	50℃	ガラス瓶(開栓)	3ヵ月	変化なし
	湿度	25℃, 90%RH	ガラス瓶(開栓)	3ヵ月	変化なし

測定項目：性状、確認試験、旋光度、融点、純度試験、乾燥減量、
HPLC法によるベポタスチンベシル酸塩の定量、光学異性体の定量、含量

3. 有効成分の確認試験法、定量法……………

<確認試験法>

日局「ベポタスチンベシル酸塩」の確認試験に準ずる。

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法
- 3) 炎色反応試験(2)
- 4) 塩化バリウム試液による沈殿反応

<定量法>

日局「ベポタスチンベシル酸塩」の定量法に準ずる。(電位差滴定法)

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」：フィルムコーティング錠

ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」：割線入り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「サワイ」：素錠(口腔内崩壊錠)

ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」：割線入り素錠(口腔内崩壊錠)

2) 製剤の外観及び性状

品名	ベポタスチン ベシル酸塩錠 5mg「サワイ」	ベポタスチン ベシル酸塩錠 10mg「サワイ」	ベポタスチン ベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」	ベポタスチン ベシル酸塩OD錠 10mg「サワイ」
外形				
性状	白色			
直径(mm)	5.6	7.1	7.0	9.5
厚さ(mm)	2.5	3.0	3.6	4.2
重量(mg)	約63	約125	約148	約296

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg/OD錠10mg「サワイ」：オレンジ様芳香、添加剤由来の甘みを有する。

3) 識別コード

●ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW BT 5

●ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW BT10

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：SW ベポタスチン OD 5

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：SW ベポタスチン OD10

4) 製剤の物性

●ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg/錠10mg「サワイ」

製剤均一性：日局ベポタスチンベシル酸塩錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局ベポタスチンベシル酸塩錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg/OD錠10mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

摩損度：日本薬局方 参考情報 錠剤の摩損度試験法により試験を行う。(25rpm、4分間)
0.19% (OD錠 5mg)、0.17% (OD錠10mg)

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

品名	ベポタスチン ベシル酸塩錠 5mg「サワイ」	ベポタスチン ベシル酸塩錠 10mg「サワイ」	ベポタスチン ベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」	ベポタスチン ベシル酸塩OD錠 10mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	日局ベポタスチンベシル酸塩			
	5mg	10mg	5mg	10mg
添加剤	カルナウバロウ、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、トレハロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、部分アルファー化デンプン、D-マンニトール		アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、クロスカルメロースNa、ステアリン酸Mg、タウマチン、二酸化ケイ素、ヒプロメロース酢酸エステルコハク酸エステル、D-マンニトール、香料	

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

6. 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「サワイ」

1) 加速試験³⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。
その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験 [※]	100.6	100.2

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁴⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH ・遮光3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH ・遮光3ヵ月)
性状	白色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	6.6	7.1	6.8	7.0	7.0
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 [※]	100.0	100.6	99.8	99.8	100.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「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 日本病院薬剤師会)に
準じて試験を実施した。

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁵⁾

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	室温 (25°C60%RH・遮光6ヵ月)
性状	白色のフィルムコーティング錠	変化なし
硬度(kg)	6.6	7.7
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験 [※]	100.0	100.4

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「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 日本病院薬剤師会)に
準じて試験を実施した。

●ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」

1) 加速試験⁶⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。
その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.3	99.4

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁷⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH ・遮光3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH ・遮光3ヵ月)
性状	白色の割線入り フィルムコー ティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	6.8	7.5	7.9	7.1	7.2
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.9	100.4	101.4	100.3

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「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 日本病院薬剤師会)に
準じて試験を実施した。

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁸⁾

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	室温 (25°C60%RH・遮光6ヵ月)
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし
硬度(kg)	6.8	7.3
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.8

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「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 日本病院薬剤師会)に
準じて試験を実施した。

IV. 製剤に関する項目

4) 分割後の安定性試験⁹⁾

本製剤を割線で二分割後、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、以下の結果が得られた。

保存条件		イニシャル	室温 (25°C60%RH・遮光3ヵ月)	光 (総照射量120万lx・hr)
性状	表面	白色	変化なし	変化なし
	分割面	白色	変化なし	変化なし
定量試験*		100.0	99.8	98.6

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「サワイ」

1) 加速試験¹⁰⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。
その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験*	101.5	101.3

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験¹¹⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH ・遮光3ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH ・遮光3ヵ月)
性状	白色の口腔内崩壊錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	7.1	6.7	6.2	6.4	6.8
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験*	100.0	100.3	101.1	100.5	101.4

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験¹²⁾

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	室温 (25°C60%RH・遮光6ヵ月)
性状	白色の口腔内崩壊錠	変化なし
硬度(kg)	7.1	6.7
崩壊試験	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.6

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」

1) 加速試験¹³⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。
その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.9	101.4

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験¹⁴⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH ・遮光3ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH ・遮光3ヵ月)
性状	白色の割線入り 口腔内崩壊錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	7.2	7.3	6.9	6.4	6.9
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.4	99.0	99.9	98.7

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

IV. 製剤に関する項目

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験¹⁵⁾

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	室温 (25°C60%RH・遮光6ヵ月)
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	変化なし
硬度(kg)	7.2	6.9
崩壊試験	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.5

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

該当資料なし

9. 溶出性

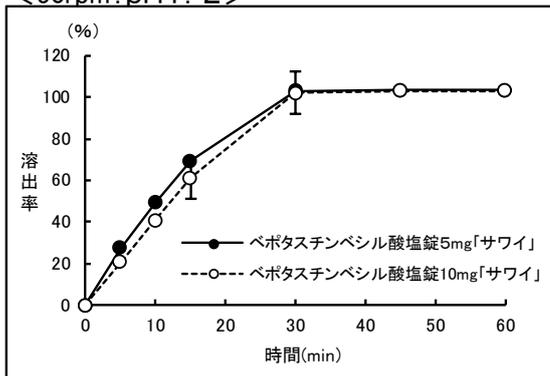
<溶出挙動における同等性及び類似性>

●ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」¹⁶⁾

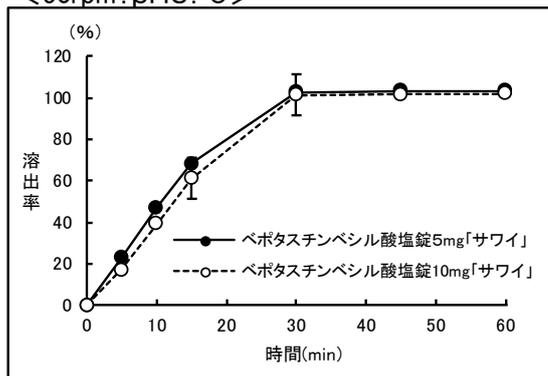
通知等	「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、3.0、6.8、水)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」	
標準製剤	ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」	
結果及び考察	<p><50rpm : pH1.2> 標準製剤の平均溶出率が60% (15分) 及び85% (30分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。最終比較時点(30分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±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かった。</p> <p><50rpm : pH3.0> 標準製剤の平均溶出率が60% (15分) 及び85% (30分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。最終比較時点(30分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p><50rpm : pH6.8> 標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (15分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±20%の範囲を超えるものがなかった。</p>	

結果及び考察	<p><50rpm : 水> f2 関数の値が50以上であった。 最終比較時点(45分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。 本剤の処方変更水準はC水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。</p>
--------	---

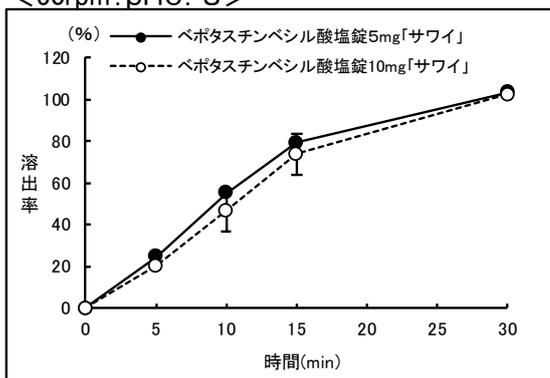
<50rpm: pH1. 2>



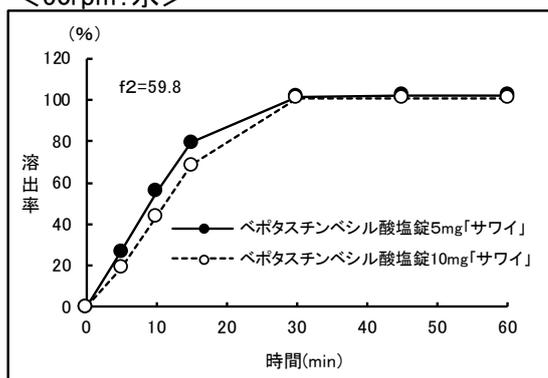
<50rpm: pH3. 0>



<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>



([] : 判定基準の適合範囲)

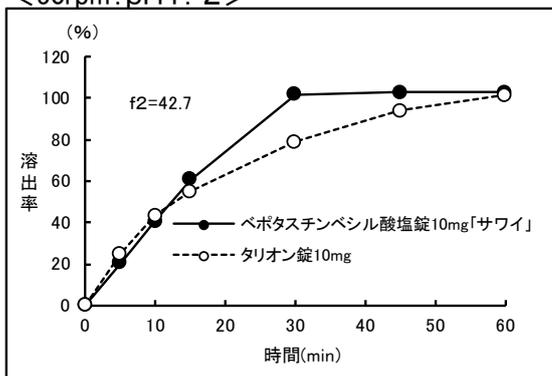
●ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」¹⁷⁾

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」:平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、3.0、6.8、水)、100rpm(pH1.2)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」	
標準製剤	タリオン錠10mg	
結果及び考察	<p><50rpm : pH1. 2> f2 関数の値が42以上であった。 <50rpm : pH3. 0> 標準製剤の平均溶出率が60% (15分) 及び85% (30分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 <50rpm : pH6. 8> 標準製剤の平均溶出率が60% (15分) 及び85% (30分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p>	

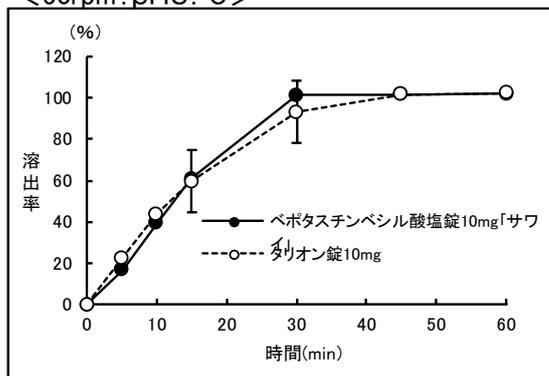
IV. 製剤に関する項目

結果及び考察	<p><50rpm : 水> 標準製剤の平均溶出率が60% (15分) 及び85% (30分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p><100rpm : pH1.2> 標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (15分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>
--------	---

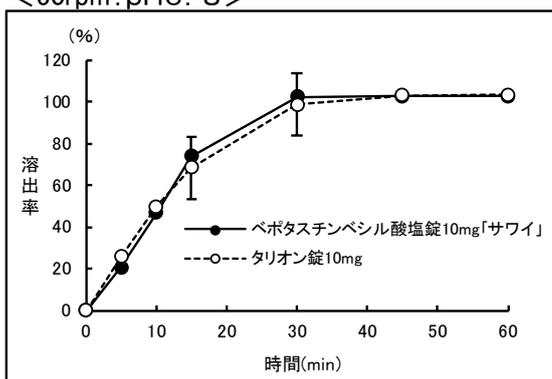
<50rpm : pH1.2>



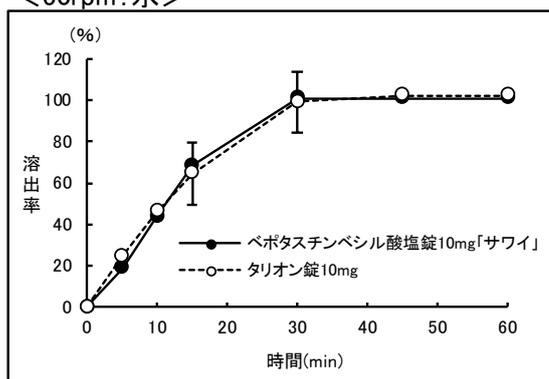
<50rpm : pH3.0>



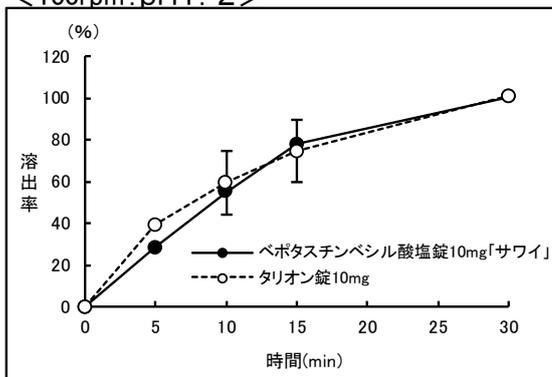
<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>



<100rpm : pH1.2>



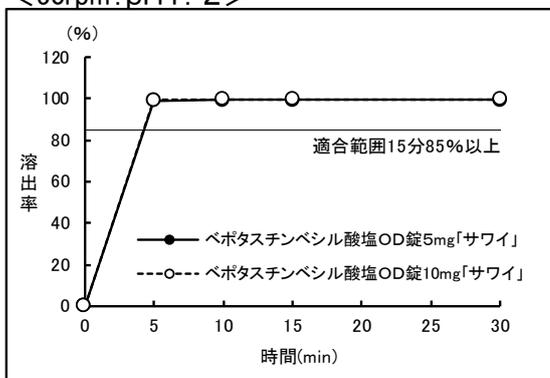
(I : 判定基準の適合範囲)

●ペポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」¹⁸⁾

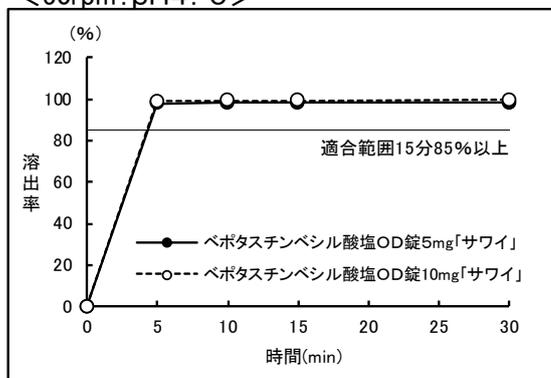
通知等	「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、4.0、6.8、水)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ペポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」	

標準製剤	ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」
結果及び考察	<p><50rpm : pH1. 2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p><50rpm : pH4. 0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p><50rpm : pH6. 8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p><50rpm : 水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。 本剤の処方変更水準はA水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。</p>

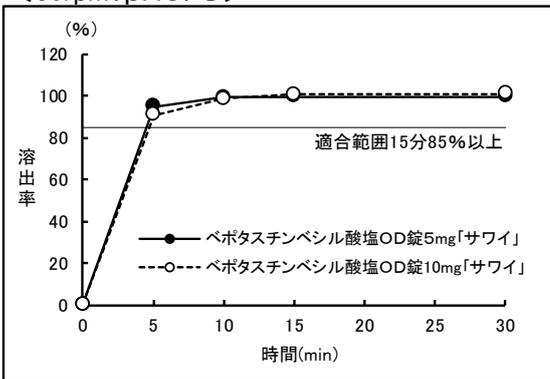
<50rpm: pH1. 2>



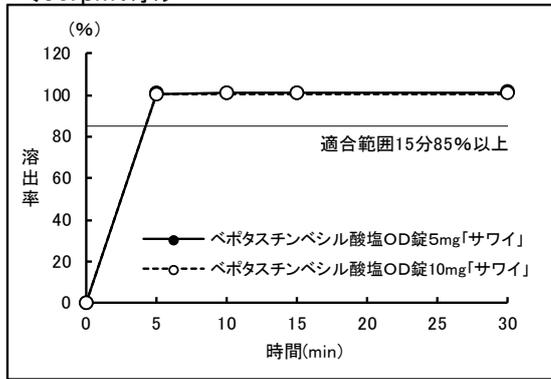
<50rpm: pH4. 0>



<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>

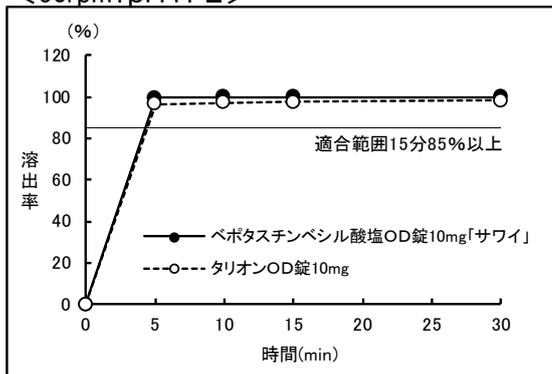


IV. 製剤に関する項目

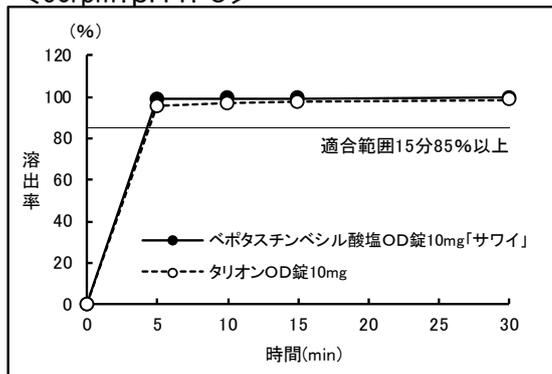
●ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」¹⁹⁾

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成24年2月29日 薬食 審査発0229第10号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」	
標準製剤	タリオンOD錠10mg	
結果及び考察	<p><50rpm：pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><50rpm：pH4.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><50rpm：pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><50rpm：水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>	

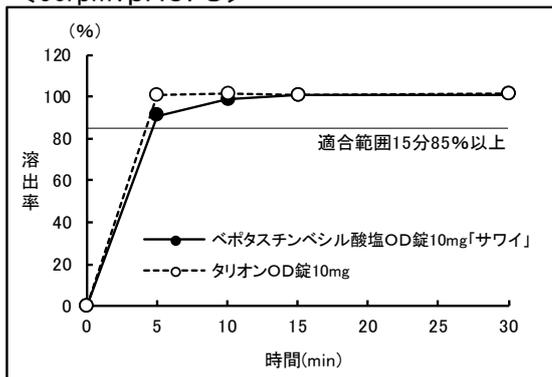
<50rpm：pH1.2>



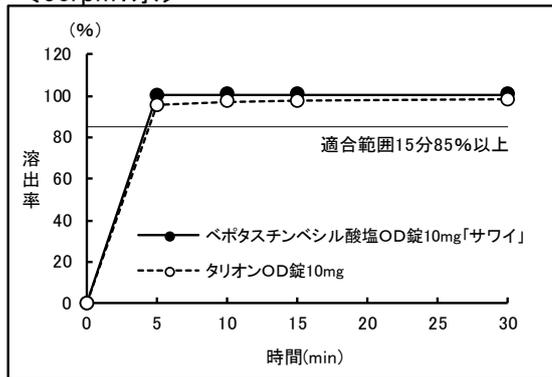
<50rpm：pH4.0>



<50rpm：pH6.8>



<50rpm：水>



10. 容器・包装

1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

〈ベポタスチンベシル酸塩錠 5 mg「サワイ」〉

PTP[乾燥剤入り]：100錠(10錠×10)

〈ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」〉

PTP[乾燥剤入り]：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

〈ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5 mg「サワイ」〉

PTP[乾燥剤入り]：100錠(10錠×10)

〈ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」〉

PTP[乾燥剤入り]：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

●ベポタスチンベシル酸塩錠 5 mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤

●ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5 mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤

11. 別途提供される資材類

該当しない

IV. 製剤に関する項目

12. その他.....

<自動分包機錠剤落下試験>

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「サワイ」²⁰⁾

湯山製作所製自動分包機による試験

試験機器： I. YS-TR-330/260FDS II (ユヤマ)
II. YS-TR-130FDX- II SE (ユヤマ)

試験方法： 本剤の無包装品について、最上段のカセットから錠剤を落下させ、それぞれ1錠ずつ50包に分包した。

試験結果

	イニシャル	25°C75%RH2週間保存品
試験機器 I	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。
試験機器 II	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。

<参考：加湿による錠剤サイズの変化>

イニシャル			→	25°C75%RH2週間保存品		
厚み (mm)	質量 (mg)	硬度 (kg)		厚み (mm)	質量 (mg)	硬度 (kg)
3.59	147.4	6.5		3.65	148.6	5.5

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」²¹⁾

湯山製作所製自動分包機による試験

試験機器： I. YS-TR-330/260FDS II (ユヤマ)
II. YS-TR-130FDX- II SE (ユヤマ)

試験方法： 本剤の無包装品について、最上段のカセットから錠剤を落下させ、それぞれ1錠ずつ50包に分包した。

試験結果

	イニシャル	25°C75%RH2週間保存品
試験機器 I	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。
試験機器 II	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。

<参考：加湿による錠剤サイズの変化>

イニシャル			→	25°C75%RH2週間保存品		
厚み (mm)	質量 (mg)	硬度 (kg)		厚み (mm)	質量 (mg)	硬度 (kg)
4.16	296.3	7.2		4.21	299.6	5.5

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

〈成人〉

- アレルギー性鼻炎
- 蕁麻疹
- 皮膚疾患に伴う痒痒(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)に伴う痒痒

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

1) 用法及び用量の解説

6. 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。

2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 腎機能障害のある患者には、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。[9.2、16.6.1参照]

5. 臨床成績

1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

2) 臨床薬理試験

該当資料なし

3) 用量反応探索試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

4) 検証的試験

(1) 有効性検証試験

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.1 国内前期第Ⅱ相試験(成人)

アレルギー性鼻炎患者(通年性)を対象にベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)を4週間経口投与したときの最終全般改善度^{注1)}(中等度改善以上)は、65.0%(13/20例)であった。

副作用は眠気4.2%(1/24例)のみであった²²⁾。

17.1.2 国内後期第Ⅱ相試験(成人)

アレルギー性鼻炎患者(通年性)を対象にベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)を4週間経口投与したときの最終全般改善度^{注1)}(中等度改善以上)は、65.3%(49/75例)であった。

副作用発現頻度は7.2%(6/83例)であった。主な副作用は眠気6.0%(5/83例)であった²³⁾。

17.1.3 国内第Ⅲ相試験(成人)

アレルギー性鼻炎患者(通年性)を対象にベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)を4週間経口投与したときの最終全般改善度^{注1)}(中等度改善以上)は、62.1%(64/103例)であった。

副作用発現頻度は5.9%(7/118例)であった。主な副作用は眠気3.4%(4/118例)、口渇1.7%(2/118例)であった²⁴⁾。

〈蕁麻疹〉

17.1.6 国内前期第Ⅱ相試験(成人)

慢性蕁麻疹患者を対象とした試験においてベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)を2週間(14±4日間)経口投与したときの最終全般改善度^{注2)}(中等度改善以上)は、75.0%(24/32例)であった。

副作用は眠気6.1%(2/33例)のみであった²⁵⁾。

17.1.7 国内後期第Ⅱ相試験(成人)

慢性蕁麻疹患者を対象とした試験においてベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)を2週間(14±4日間)経口投与したときの最終全般改善度^{注2)}(中等度改善以上)は、76.1%(67/88例)であった。

副作用発現頻度は10.4%(10/96例)であった。主な副作用は眠気6.3%(6/96例)であった²⁶⁾。

17.1.8 国内第Ⅲ相試験(成人)

慢性蕁麻疹患者を対象としてベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)を2週間(14±4日間)経口投与したときの最終全般改善度^{注2)}(中等度改善以上)は、76.9%(100/130例)であった。

副作用発現頻度は12.7%(18/142例)であった。主な副作用は眠気7.7%(11/142例)、口渇2.8%(4/142例)であった^{27, 28)}。

注1)主症状であるくしゃみ、鼻汁、鼻閉を中心に、症状・所見の推移をもとに5段階で判定(著明改善:著しい症状の改善を認める、中等度改善:かなり症状の改善を認める、軽度改善:わずかな症状の改善を認める、不変:症状に変化がない、悪化:観察期間に比べて症状の悪化を認める)

注2)そう痒及び発斑(膨疹・紅斑)の推移をもとに5段階で判定(著明改善:いずれも消失するかそう痒が消失して発斑が著しく軽快、中等度改善:いずれもかなり軽快、軽度改善:やや軽快、不変:変化がない、悪化)

(2) 安全性試験

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.5 国内第Ⅲ相長期投与試験(小児)

小児(7~15歳)のアレルギー性鼻炎患者(通年性)58例を対象とした投与12週間の長期投与試験(非盲検)において、ベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)の鼻の3主徴(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉)合計スコアのベースラインからの変化量(平均値±標準偏差)は投与2週時-0.943±1.549、投与4週時-1.388±1.465、投与12週時-1.451±1.707であった。

副作用発現頻度は3.4%(2/58例)であった。副作用の内訳は傾眠、肝機能検査異常いずれも1.7%(1/58例)であった²⁹⁾。

17.3 その他

17.3.1 眠気及び精神運動能に対する影響

(1) プラセボを対照薬とした慢性蕁麻疹の二重盲検群間比較試験において、ベポタスチンベシル酸塩投与群[20mg/日](55例)の眠気の副作用発現頻度は、プラセボ投与群(54例)と同程度であった³⁰⁾。[8.1参照]

(2) 小児(7~15歳)を対象とした4試験の統合解析の結果、眠気の副作用発現頻度はプラセボ群で0.3%(1/395例)、ベポタスチンベシル酸塩20mg/日投与群で0.8%(5/615例)であった^{29, 31, 32, 33)}。[8.1参照]

(3) 健康成人男子を対象に連続加算テストによる精神運動機能に及ぼす影響を検討した結果、ベポタスチンベシル酸塩投与群の正答数の変化率はプラセボ投与群と有意差がなく、精神運動機能に対する影響は認められなかった³⁴⁾。[8.1参照]

5) 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(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

7) その他

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.4 国内第Ⅲ相試験(小児)

小児(7~15歳)のアレルギー性鼻炎患者(通年性)を対象とした投与2週間の二重盲検比較試験において、ベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)群(240例)及びプラセボ群(232例)における鼻の3主徴(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉)合計スコア(最終評価時)のベースラインからの変化量(平均値±標準偏差)はそれぞれ-1.587±1.332及び-1.102±1.462であり、共分散分析(投与群を因子、投与前スコアを共変量)の結果、ベポタスチンベシル酸塩20mg/日のプラセボに対する優越性が検証された($p < 0.001$)。

副作用発現頻度は、ベポタスチンベシル酸塩20mg/日群で1.7%(4/240例)であった。副作用の内訳は尿中血陽性、ALT増加、AST増加、肝機能検査異常及び白血球数増加いずれも0.4%(1/240例)であった^{31, 35)}。

V. 治療に関する項目

〈蕁麻疹〉

17.1.9 国内第Ⅲ相試験(成人)

投与期間を1週間(7+2日間)とし、プラセボを対照薬とした慢性蕁麻疹の二重盲検比較試験において、ベポタスチンベシル酸塩はプラセボと比較して、そう痒及び発斑の症状スコアを有意に減少させた。

症状	薬剤群	例数	投与前日		最終投与時		変化量		検定 (無制約 LSD法)
			平均値	標準誤差	平均値	標準誤差	平均値	標準誤差	
そう痒	10mg×2	55	2.75	0.09	1.13	0.12	-1.62	0.14	p<0.0001
	プラセボ	54	2.70	0.09	2.56	0.12	-0.15	0.13	
発斑	10mg×2	55	2.33	0.06	0.84	0.12	-1.49	0.12	p<0.0001
	プラセボ	54	2.30	0.06	1.83	0.11	-0.46	0.11	

副作用発現頻度は、ベポタスチンベシル酸塩群で10.9%(6/55例)であった。主な副作用は、眠気5.5%(3/55例)、悪心5.5%(3/55例)、めまい3.6%(2/55例)であった³⁰⁾。

〈皮膚疾患に伴う瘙痒(湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症)〉

17.1.10 国内第Ⅲ相試験(成人)

患者217例を対象としてベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)を2週間(14±4日間)経口投与した一般臨床試験の最終全般改善度(中等度改善以上)は、全体で64.7%(119/184例)で、疾患群別では湿疹・皮膚炎群63.1%(65/103例)、痒疹群73.2%(30/41例)、皮膚そう痒症60.0%(24/40例)であった。

副作用発現頻度は、全体で9.2%(19/206例)で、疾患群別では湿疹・皮膚炎群8.5%(10/117例)、痒疹群6.7%(3/45例)、皮膚そう痒症13.6%(6/44例)であった。主な副作用は、いずれの群においても眠気で、全体で5.8%(12/206例)、湿疹・皮膚炎群4.3%(5/117例)、痒疹群4.4%(2/45例)、皮膚そう痒症11.4%(5/44例)であった³⁶⁾。

〈アトピー性皮膚炎〉

17.1.11 国内第Ⅲ相試験(小児)

小児(7~15歳)を対象とした投与2週間の二重盲検比較試験において、ベポタスチンベシル酸塩20mg/日(1回10mg、1日2回)群(151例)及びケトチフェンマル酸塩群(152例)におけるそう痒スコア(最終評価時)のベースラインからの変化量(平均値±標準偏差)はそれぞれ-0.674±0.723及び-0.634±0.762であり、共分散分析(投与群を因子、投与前スコアを共変量)の結果、ベポタスチンベシル酸塩20mg/日のケトチフェンマル酸塩ドラッグに対する非劣性が検証された(スコア変化量の調整済平均値の群間差の95%信頼区間上限が0.4以下)。

副作用は、ベポタスチンベシル酸塩20mg/日群で傾眠2.0%(3/151例)のみであった³²⁾。

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

抗ヒスタミン作用：ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、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、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、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩³⁷⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

血管透過性亢進及び平滑筋収縮に関与するヒスタミンに対する拮抗作用、ならびに好酸球機能の活性化に関与するインターロイキン-5の産生抑制作用と考えられる¹⁾。

2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ヒスタミンH₁受容体拮抗作用

18.2.1 ベポタスチンベシル酸塩はH₁受容体に対して選択的親和性を示し、5-HT₂、 α_1 、 α_2 、muscarinic受容体等に対しては親和性を示さなかった³⁸⁾ (in vitro)。

18.2.2 ベポタスチンベシル酸塩はヒスタミンによる皮膚血管透過性亢進(ラット、モルモット)を経口投与で抑制し、in vitroにおいてはヒスタミンによるモルモットの摘出平滑筋(気管支、回腸)の収縮を濃度依存的に抑制する^{39,40)}。

18.3 I型アレルギー反応抑制作用

18.3.1 ベポタスチンベシル酸塩は経口投与により受身皮膚アナフィラキシー(PCA)反応(ラット、モルモット)、アナフィラキシー性ショック(モルモット)ならびに抗原により誘発される気道収縮(モルモット)を抑制する^{39,40)}。

18.3.2 ベポタスチンベシル酸塩は経口投与により実験的アレルギー性鼻炎モデル(モルモット)における鼻腔抵抗の上昇ならびに抗原により誘発される鼻粘膜の血管透過性亢進(ラット)を抑制する^{41,42)}。

18.4 好酸球に対する作用

18.4.1 ベポタスチンベシル酸塩の経口投与は血小板活性化因子(PAF)(ラット、モルモット)及び抗原による(モルモット、マウス)好酸球浸潤を抑制する^{43,44)}。

18.4.2 ベポタスチンベシル酸塩の経口投与は抗原により誘発される末梢血中好酸球の増多(マウス)を抑制する⁴⁵⁾。

18.5 サイトカインの産生に対する作用

ベポタスチンベシル酸塩はヒト末梢血単核球におけるインターロイキン-5の産生を抑制する⁴⁶⁾ (in vitro)。

VI. 薬効薬理に関する項目

18.6 一般薬理作用

18.6.1 ベポタスチンベシル酸塩の中樞神経系、呼吸・循環器系、消化器系、自律神経系・平滑筋、腎機能、代謝系及び血液系の一般薬理試験において特記すべき所見は認められていない(マウス、ラット、モルモット及びイヌ)^{38, 47)}。

18.6.2 ベポタスチンベシル酸塩の眠気誘発作用(マウス、ネコ)及び催不整脈作用(イヌ、モルモット)について検討したがこれらの作用は認められなかった⁴⁸⁾。

18.7 ヒスタミン誘発皮内反応試験

健康成人を対象としたヒスタミン誘発皮内反応試験において、ベポタスチンベシル酸塩 5、10mgの経口投与で、膨疹及び紅斑を用量依存的に抑制し、投与後12時間においてもプラセボに比し有意に抑制した³⁴⁾。

3) 作用発現時間・持続時間

作用持続時間：VI. -2. -2) 参照

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

〈成人〉

16.1.1 反復投与

健康成人男性にベポタスチンベシル酸塩20mgを1日2回7日間反復投与した時、蓄積性は認められず、投与開始2日目には血漿中濃度推移はほぼ定常状態に達した(最終投与後のC_{max}=138.4±9.6ng/mL、平均値±S. E.、n=6)⁴⁹⁾。

〈小児〉

16.1.2 反復投与

7～15歳の小児通年性アレルギー性鼻炎患者及び小児アトピー性皮膚炎患者にベポタスチンベシル酸塩10mgを1日2回2週間反復経口投与したときの投与後1～3時間及び投与後9～11時間の血漿中ベポタスチン濃度は以下のとおりである⁵⁰⁾。

	通年性アレルギー性鼻炎患者		アトピー性皮膚炎患者
	C _{1-3hr} ^{※1}	C _{9-11hr} ^{※2}	C _{9-11hr} ^{※2}
平均値±標準偏差(例数)	92.0±56.1(62)	8.2±4.0(43)	8.3±4.1(106)

(ng/mL)

※1：投与1週時点、※2：投与2週時点

注)本剤の承認用量はベポタスチンベシル酸塩として1回10mg、1日2回である。

〈生物学的同等性試験〉

●ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「サワイ」¹⁶⁾

16.8 その他

〈ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「サワイ」〉

ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「サワイ」は溶出挙動に基づき、ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」と生物学的に同等とみなされた。

IV. -9. 参照

●ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」^{51, 52)}

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号
採血時点	0、0.5、1、1.5、2、3、4、6、8、10hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」
標準製剤	タリオン錠10mg

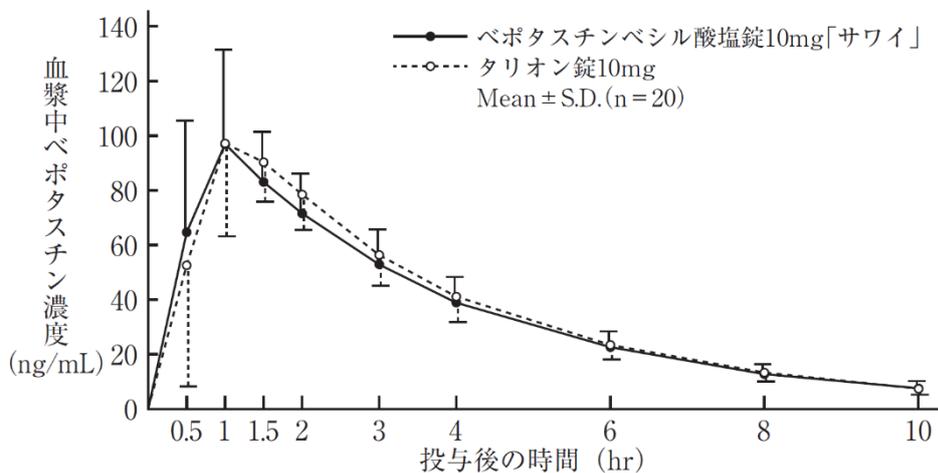
ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」とタリオン錠10mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(ベポタスチンベシル酸塩として10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ベポタスチン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC_t、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-10hr} (ng・hr/mL)
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「サワイ」	105.8±26.3	1.2±0.7	2.5±0.3	365.9±45.8
タリオン錠10mg	109.1±26.1	1.2±0.3	2.4±0.3	378.1±52.3

(Mean±S.D.)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC _{0-10hr}	log (0.97)	log (0.94) ~ log (1.00)
Cmax	log (0.97)	log (0.87) ~ log (1.07)

血漿中濃度ならびにAUCt、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。

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「サワイ」¹⁸⁾

16.8 その他

〈ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「サワイ」〉

ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「サワイ」は溶出挙動に基づき、ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」と生物学的に同等とみなされた。

IV. -9. 参照

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」^{53, 54)}

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号
採血時点	0、0.25、0.5、1、1.5、2、3、4、6、8、10hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」
標準製剤	タリオンOD錠10mg

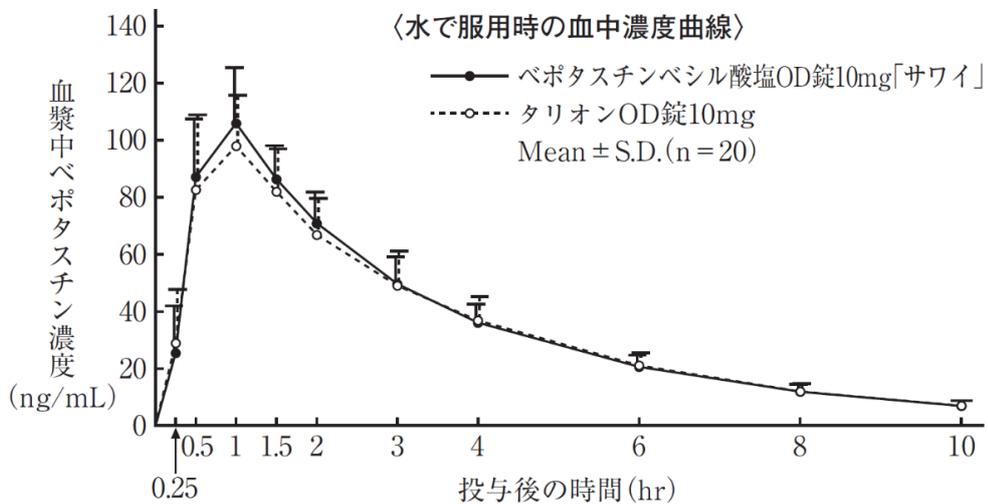
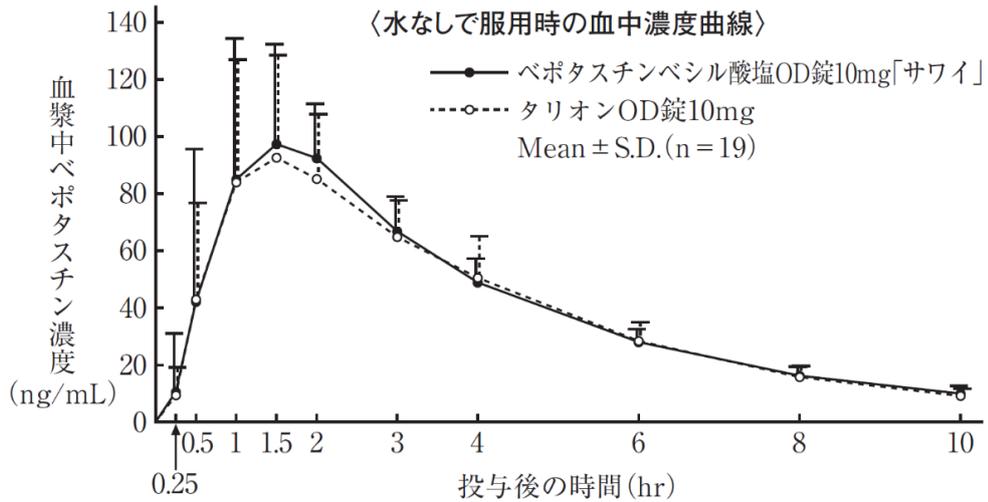
ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」とタリオンOD錠10mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(ベポタスチンベシル酸塩として10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ベポタスチン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-10hr} (ng・hr/mL)
水なし	ベポタスチンベシル酸塩 OD錠10mg「サワイ」	122.8±34.2	1.6±0.6	2.6±0.3	416.8±65.5
	タリオンOD錠10mg	108.4±26.1	1.6±0.9	2.4±0.3	407.9±66.5
水あり	ベポタスチンベシル酸塩 OD錠10mg「サワイ」	110.0±16.6	1.0±0.3	2.5±0.3	363.2±40.6
	タリオンOD錠10mg	103.1±15.1	0.9±0.3	2.5±0.3	354.8±47.0

(Mean±S.D.)



		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUC _{0-10hr}	log(1.02)	log(1.00) ~ log(1.05)
	Cmax	log(1.13)	log(1.05) ~ log(1.22)
水あり	AUC _{0-10hr}	log(1.03)	log(1.00) ~ log(1.05)
	Cmax	log(1.07)	log(1.02) ~ log(1.12)

血漿中濃度ならびにAUC_t、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。

VII. 薬物動態に関する項目

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

16.2.1 食事の影響

血漿中ベポタスチン濃度に及ぼす食事の影響はほとんど認められなかった⁵⁵⁾。

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) 消失速度定数

●ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ベポタスチンベシル酸塩として10mg)空腹時単回経口投与した場合のベポタスチンの消失速度定数^{51, 52)}

$0.282 \pm 0.029 \text{hr}^{-1}$

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ベポタスチンベシル酸塩として10mg)空腹時単回経口投与した場合のベポタスチンの消失速度定数^{53, 54)}

[水なし] $0.275 \pm 0.033 \text{hr}^{-1}$ 、[水あり] $0.279 \pm 0.037 \text{hr}^{-1}$

4) クリアランス

該当資料なし

5) 分布容積

該当資料なし

6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

1) 解析方法

該当資料なし

2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

16.2 吸収

16.2.2 バイオアベイラビリティ

健康成人男性にベポタスチンベシル酸塩を単回経口投与したときの尿中排泄率からバイオアベイラビリティは約82%と推定された⁵⁵⁾。

5. 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. -6. -5) 参照

3) 乳汁への移行性

VIII. -6. -6) 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

6) 血漿蛋白結合率

16.3 分布

健康成人男性にベポタスチンベシル酸塩10mgを単回経口投与したときの投与1及び2時間後の血漿蛋白結合率は55.9及び55.0%であった⁵⁶⁾。

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

健康成人男性にベポタスチンベシル酸塩を経口投与したとき、血漿中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(ベポタスチン)として尿中に排泄された⁵⁵⁾。

2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人男性6例にベポタスチンベシル酸塩2.5～40mgを単回経口投与した場合、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錠を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^{49,55)}。

注) 本剤の承認用量はベポタスチンベシル酸塩として1回10mg、1日2回である。

VII. 薬物動態に関する項目

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

腎機能障害患者(クレアチニンクリアランス 6～70mL/min)にベポタスチンベシル酸塩 5mgを単回経口投与した場合、腎機能正常者に比べ腎機能低下に伴い最高血漿中濃度は若干の上昇がみられ、AUCは明らかに上昇した。腎機能障害患者に反復経口投与したときの定常状態における最高血漿中濃度は腎機能正常者に比べ1.2～1.8倍に増加することが予測された⁵⁷⁾。[7.1、9.2参照]

腎機能障害患者の分類 (クレアチニンクリアランス)	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	t _{1/2} (hr)	AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)
腎機能正常者 (n=5) (>70mL/min)	1.2±0.4	55.1±16.8	2.9±0.5	241.1±50.6
軽度腎機能障害患者 (n=5) (51～70mL/min)	1.0±0.0	61.0±10.8	3.1±0.6	304.0±61.7
中等度又は高度 腎機能障害患者 (n=6) (6～50mL/min)	3.3±1.0	66.3±7.7	8.5±3.6	969.1±398.3

(平均値±標準偏差)

16.6.2 高齢者

65歳以上の健康高齢者男性(クレアチニンクリアランス61.7～126.7mL/min)にベポタスチンベシル酸塩10mgを1日2回3日間(最終日は1回)反復経口投与したときの最終投与後の最高血漿中濃度は103.8±13.2ng/mL(平均値±標準偏差、n=10)であった⁵⁸⁾。[9.8参照]

11. その他

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……………
設定されていない

2. 禁忌内容とその理由……………

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)
2.1 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注意とその理由……………
設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………
V. -4. 参照

5. 重要な基本的注意とその理由……………

8. 重要な基本的注意
〈効能共通〉
8.1 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。[17. 3. 1参照]
8.2 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。
〈アレルギー性鼻炎〉
8.3 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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意……………

1) 合併症・既往歴等のある患者

- 9.1 合併症・既往歴等のある患者
9.1.1 長期ステロイド療法を受けている患者
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。

2) 腎機能障害患者

- 9.2 腎機能障害患者
本剤の血漿中濃度を上昇させることがある。また、高い血漿中濃度が持続するおそれがある。[7. 1、16. 6. 1参照]

3) 肝機能障害患者

設定されていない

4) 生殖能を有する者

設定されていない

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。動物実験(ラット)で胎児への移行が認められている。

6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。

7) 小児等

9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児又は幼児を対象とした臨床試験は実施していない⁵⁹⁾。

8) 高齢者

9.8 高齢者

高い血漿中濃度が持続するおそれがある。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。[16.6.2参照]

7. 相互作用.....

1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用.....

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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。

1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	0.1～5%未満	0.1%未満	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、めまい		頭重感
消化器	口渇、悪心、胃痛、胃部不快感、下痢、口内乾燥、嘔吐	舌炎、腹痛	便秘
過敏症	発疹、蕁麻疹	腫脹	
肝臓	AST、ALT、 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、味覚異常	動悸、呼吸困難、しびれ

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

〈製剤共通〉

14.1.1 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ある。

〈OD錠〉

14.1.2 舌の上に乗せて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

14.1.3 寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

12. その他の注意

1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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) 安全性薬理試験
該当資料なし
 - 3) 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) 遺伝毒性試験
該当資料なし
 - 4) がん原性試験
該当資料なし
 - 5) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
 - 6) 局所刺激性試験
該当資料なし
 - 7) 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

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

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

該当しない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬

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

同効薬：抗ヒスタミン作用

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、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、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、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩³⁷⁾

7. 国際誕生日

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日……………

製品名	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
ベポタスチンベシル酸塩 錠5mg「サワイ」	2018年2月15日	23000AMX00351000	2018年6月15日	2018年6月15日
ベポタスチンベシル酸塩 錠10mg「サワイ」	2018年2月15日	23000AMX00352000	2018年6月15日	2018年6月15日
ベポタスチンベシル酸塩 OD錠5mg「サワイ」	2018年2月15日	23000AMX00255000	2018年6月15日	2018年6月15日
ベポタスチンベシル酸塩 OD錠10mg「サワイ」	2018年2月15日	23000AMX00256000	2018年6月15日	2018年6月15日

9. 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……………

承認年月日：2019年11月6日

効能又は効果内容：小児に対する「アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚搔痒症)に伴う搔痒」の効能又は効果を追加した。

用法及び用量内容：効能又は効果追加に伴い、関連の用法及び用量を追加した。

10. 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

11. 再審査期間……………

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報……………

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。

13. 各種コード……………

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
ベポタスチンベシル酸塩 錠5mg「サワイ」	4490022F1011	4490022F1097	126379401	622637901
ベポタスチンベシル酸塩 錠10mg「サワイ」	4490022F2093	4490022F2093	126380001	622638001
ベポタスチンベシル酸塩 OD錠5mg「サワイ」	4490022F3014	4490022F3057	126377001	622637701
ベポタスチンベシル酸塩 OD錠10mg「サワイ」	4490022F4053	4490022F4053	126378701	622637801

14. 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) 作用機序(タリオン錠：2000年7月3日承認、申請資料概要ホ. 総括. 2)
- 2) 医療用医薬品最新品質情報集(ブルーブック) <<https://www.nihs.go.jp/drug/ecqaged/bluebook/list.html>> (2024/11/1 アクセス)
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 11) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 12) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 13) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」
- 14) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」
- 15) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」
- 16) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」
- 17) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」
- 18) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 19) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」
- 20) 沢井製薬(株) 社内資料[自動分包機錠剤落下試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 21) 沢井製薬(株) 社内資料[自動分包機錠剤落下試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」
- 22) 馬場駿吉他：臨床医薬，1997；13(5)：1217-1235
- 23) 馬場駿吉他：臨床医薬，1997；13(5)：1259-1286
- 24) 馬場駿吉他：臨床医薬，1997；13(5)：1307-1335
- 25) 石橋康正他：臨床医薬，1997；13(5)：1199-1215
- 26) 石橋康正他：臨床医薬，1997；13(5)：1237-1257
- 27) 石橋康正他：臨床医薬，1997；13(5)：1287-1306
- 28) 慢性蕁麻疹患者を対象とした国内第Ⅲ相試験(成人)(タリオン錠：2000年7月3日承認、申請資料概要ト. I. 7. (3))
- 29) 大久保公裕他：アレルギー・免疫，2015；22(4)：578-589
- 30) 川島真他：臨床医薬，2002；18(4)：501-519
- 31) 小児通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした検証的試験[2013]①(タリオン錠/OD錠：2015年5月26日承認、申請資料概要2. 7. 6. 4)
- 32) 川島真他：臨床医薬，2015；31(3)：235-251

X I. 文献

- 33) 小児通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした検証的試験[2011](タリオン錠/OD錠：2015年5月26日承認、申請資料概要2.7.6.3)
- 34) 石橋康正他：臨床医薬，1997；13(5)：1187-1197
- 35) 小児通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした検証的試験[2013]②(タリオン錠/OD錠：2015年5月26日承認、審査報告書)
- 36) 石橋康正他：臨床医薬，1997；13(5)：1383-1400
- 37) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2024/11/1 アクセス)
- 38) Kato, M. et al. : *Arzneimittelforschung*, 1997 ; 47(10) : 1116-1124
- 39) 谷藤直子他：日本薬理学雑誌，1997；110：19-29
- 40) 本田浩子他：薬理と治療，1997；25(4)：879-888
- 41) 坂本修身他：薬理と治療，1997；25(4)：889-894
- 42) 村田隆司他：アレルギー，1997；46(7)：576-584
- 43) Ueno, M. et al. : *Pharmacology*, 1998 ; 57(4) : 206-214
- 44) 好酸球に対する作用(タリオン錠：2000年7月3日承認、申請資料概要ホ. I. 4)
- 45) Sakai, A. et al. : *Arzneimittelforschung*, 1997 ; 47(8) : 954-958
- 46) Kaminuma, O. et al. : *Biol. Pharm. Bull.*, 1998 ; 21(4) : 411-413
- 47) 成田寛他：薬理と治療，1997；25(4)：907-924
- 48) 一般薬理作用(タリオン錠：2000年7月3日承認、申請資料概要ホ. II. 8)
- 49) 門阪利雄他：臨床医薬，1997；13(5)：1155-1168
- 50) 小児と成人の薬物動態の比較(タリオン錠/OD錠：2015年5月26日承認、申請資料概要2.7.2.3.1, 2.7.2.3.3)
- 51) 花田隆造他：診療と新薬，2018；55(4)：296-301
- 52) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」
- 53) 中川美聡他：診療と新薬，2018；55(5)：352-360
- 54) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」
- 55) 横田秀雄他：臨床医薬，1997；13(5)：1137-1153
- 56) 分布(タリオン錠：2000年7月3日承認、申請資料概要へ. II. 2.(6))
- 57) 川島一剛他：臨床医薬，2003；19(6)：637-648
- 58) 熊谷雄治他：臨床医薬，1997；13(5)：1169-1185
- 59) 馬場駿吉：臨床医薬，2002；18(12)：1371-1387
- 60) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「サワイ」
- 61) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」
- 62) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「サワイ」
- 63) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」
- 64) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「サワイ」
- 65) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」
- 66) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「サワイ」
- 67) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

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

<粉砕後の安定性試験>

●ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」⁶⁰⁾

本製剤を粉砕後、下記条件で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験*	100.0	101.6	101.1	101.4

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」⁶¹⁾

本製剤を粉砕後、下記条件で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験*	100.0	101.3	101.5	101.1

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」⁶²⁾

本製剤を粉砕後、下記条件で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験*	100.0	99.5	100.1	97.6

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」⁶³⁾

本製剤を粉砕後、下記条件で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験*	100.0	98.9	98.8	99.0

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

<崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験>

●ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「サワイ」⁶⁴⁾

試験方法

1. 本剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取した。
2. 5分放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。
崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返した。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。

結 果

懸 濁 状 態	5分後	錠剤は完全には崩壊しなかった
	10分後	錠剤は完全には崩壊しなかった
	15分後	錠剤は崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した	

備考

- ・コーティングを破壊して試験を行った。錠剤は5分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8Fr.チューブを通過した。

●ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「サワイ」⁶⁵⁾

試験方法

1. 本剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取した。
2. 5分放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。
崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返した。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。

結 果

懸 濁 状 態	5分後	錠剤は完全には崩壊しなかった
	10分後	錠剤は完全には崩壊しなかった
	15分後	錠剤は崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した	

備考

- ・コーティングを破壊して試験を行った。錠剤は5分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8Fr.チューブを通過した。

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5mg「サワイ」⁶⁶⁾

試験方法

1. 本剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取した。
2. 5分放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。
崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返した。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。

結 果

懸 濁 状 態	錠剤は1分以内に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった	
チューブ通過性	通過した	

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「サワイ」⁶⁷⁾

試験方法

1. 本剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取した。
2. 5分放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。
崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返した。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。

結果

懸濁状態	錠剤は1分以内に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した

2. その他の関連資料

患者向け資材

●ベポタスチンベシル酸塩錠5mg/錠10mg/OD錠5mg/OD錠10mg「サワイ」

- ・気になる皮膚のかゆみ じんましん
- ・花粉症のセルフケアと治療法
- ・自動車運転等は注意してください・お知らせ指導箋

●ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg/OD錠10mg「サワイ」

- ・OD錠を服用される患者さんへ OD錠という選択肢

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

