

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

血管拡張性 β_1 遮断剤

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg/10mg「トローワ」

BETAXOLOL HYDROCHLORIDE TABLETS 5 mg "TOWA" / TABLETS 10 mg "TOWA"

《ベタキソロール塩酸塩錠》

製 品 名	ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「トローワ」	ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トローワ」
剤 形	フィルムコーティング錠	
製 剤 の 規 制 区 分	処方箋医薬品 ^{注1)} 注1) 注意－医師等の処方箋により使用すること	
規 格 ・ 含 量	1錠中 日局 ベタキソロール 塩酸塩 5mg 含有	1錠中 日局 ベタキソロール 塩酸塩 10mg 含有
一 般 名	和 名：ベタキソロール塩酸塩 (JAN) 洋 名：Betaxolol hydrochloride (JAN)	
製 造 販 売 承 認 年 月 日	2017年 2月 1日	
薬 価 基 準 収 載 年 月 日	2017年 6月 16日	
発 売 年 月 日	2004年 7月 9日	2002年 7月 5日
開 発 ・ 製 造 販 売 (輸 入) ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製造販売元：東和薬品株式会社	
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	電話番号： FAX：	
問 い 合 わ せ 窓 口	東和薬品株式会社 学術部 DIセンター  0120-108-932 FAX 06-7177-7379 https://med.towayakuhin.co.jp/medical/	

本 IF は 2019年 2月改訂(第12版、副作用の項)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情報提供ホームページ

<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。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供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 が添付文書を保管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、添付文書で赤字・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

[IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」(以下、「IF記載要領 2013」と略す)により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「IF記載要領 2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領 2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供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情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後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)

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	24
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	24
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	24
II. 名称に関する項目	2	3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	24
1. 販売名	2	4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	24
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	24
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	25
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	25
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	27
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	28
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	28
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	28
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	28
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	13. 過量投与	28
3. 有効成分の確認試験法	5	14. 適用上の注意	29
4. 有効成分の定量法	5	15. その他の注意	29
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	29
1. 剤形	6	IX. 非臨床試験に関する項目	30
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	30
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7	2. 毒性試験	30
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	X. 管理的事項に関する項目	31
5. 調製法及び溶解後の安定性	11	1. 規制区分	31
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	11	2. 有効期間又は使用期限	31
7. 溶出性	12	3. 貯法・保存条件	31
8. 生物学的試験法	16	4. 薬剤取扱い上の注意点	31
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	16	5. 承認条件等	31
10. 製剤中の有効成分の定量法	16	6. 包装	31
11. 力価	16	7. 容器の材質	32
12. 混入する可能性のある夾雑物	16	8. 同一成分・同効薬	32
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	16	9. 国際誕生年月日	32
14. その他	16	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	32
V. 治療に関する項目	17	11. 薬価基準収載年月日	32
1. 効能・効果	17	12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	32
2. 用法・用量	17	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	32
3. 臨床成績	17	14. 再審査期間	33
VI. 薬効薬理に関する項目	19	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	33
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	19	16. 各種コード	33
2. 薬理作用	19	17. 保険給付上の注意	33
VII. 薬物動態に関する項目	20	XI. 文 献	34
1. 血中濃度の推移・測定法	20	1. 引用文献	34
2. 薬物速度論的パラメータ	21	2. その他の参考文献	34
3. 吸収	21	XII. 参考資料	34
4. 分布	22	1. 主な外国での発売状況	34
5. 代謝	22	2. 海外における臨床支援情報	34
6. 排泄	22	XIII. 備 考	35
7. トランスポーターに関する情報	23	その他の関連資料	35
8. 透析等による除去率	23		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ベタキソロール塩酸塩錠は血管拡張性 β_1 遮断剤であり、本邦では1992年に上市されている。東和薬品株式会社が後発医薬品として、ケフナン錠5mg及びケフナン錠10の開発を企画し、医薬発第481号(平成11年4月8日)に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2004年2月、2002年3月にそれぞれ承認を取得し、2004年7月、2002年7月に発売した。

その後、医療事故防止のため、ケフナン錠10は2004年7月にケフナン錠10mgと販売名の変更を行った。

更に、2017年6月にベタキソロール塩酸塩錠5mg「トーワ」及びベタキソロール塩酸塩錠10mg「トーワ」とそれぞれ販売名の変更を行い、現在に至る。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

臨床的特性

有用性：ベタキソロール塩酸塩錠5mg「トーワ」及びベタキソロール塩酸塩錠10mg「トーワ」は、本態性高血圧症(軽症～中等症)に対しては、通常、成人にはベタキソロール塩酸塩として5～10mgを1日1回経口投与、腎実質性高血圧症に対しては、通常、成人にはベタキソロール塩酸塩として5mgを1日1回経口投与、狭心症に対しては、通常、成人にはベタキソロール塩酸塩として10mgを1日1回経口投与することにより、有用性が認められている。

安全性：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。

副作用として、徐脈、低血圧、ふらふら感、頭痛、めまい、ぼんやり、下痢、嘔吐、肝機能障害〔AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、 γ -GTP上昇、LDH上昇等〕、呼吸困難、喘息症状、けん怠感、浮腫、尿酸値上昇、中性脂肪上昇、コレステロール上昇、高血糖、CK(CPK)上昇、HDL-コレステロール低下等が報告されている。〔VIII. 8. (3) その他の副作用の項を参照〕
重大な副作用として、完全房室ブロック、心胸比増大、心不全があらわれることがある。〔VIII. 8. (2) 重大な副作用と初期症状の項を参照〕

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」

(2) 洋名

BETAXOLOL HYDROCHLORIDE TABLETS 5 mg “TOWA”
BETAXOLOL HYDROCHLORIDE TABLETS 10 mg “TOWA”

(3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格(含量)＋「トーワ」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

ベタキソロール塩酸塩 (JAN)

(2) 洋名(命名法)

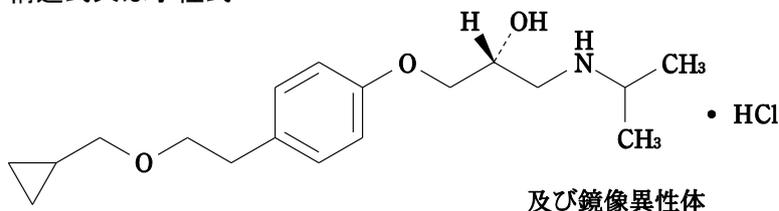
Betaxolol Hydrochloride (JAN)

Betaxolol (INN)

(3) ステム

-olol : propranolol 系の β -交感神経遮断剤

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{18}H_{29}NO_3 \cdot HCl$

分子量 : 343.89

5. 化学名(命名法)

(2*RS*)-1-{4-[2-(Cyclopropylmethoxy)ethyl]phenoxy}-3-[(1-methylethyl) amino]propan-2-ol monohydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：塩酸ベタキシロール

7. CAS登録番号

63659-19-8

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

溶 媒	1g を溶かすのに要する溶媒量	溶 解 性
水	1mL 未満	極めて溶けやすい
メタノール	1mL 以上 10mL 未満	溶けやすい
エタノール(99.5)	1mL 以上 10mL 未満	溶けやすい
酢酸(100)	1mL 以上 10mL 未満	溶けやすい

(3) 吸 湿 性

該当資料なし

(4) 融点(分解点)・沸点・凝固点

融点：114～117℃

(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

施光度：本品の水溶液(1→100)は施光性を示さない。

pH：本品 1.0g を水 50mL に溶かした液の pH は 4.5～6.5 である。

吸光度 $E_{1\text{cm}}^{1\%}$ (276nm)：42.8 [本品のエタノール(99.5)溶液(1→10000)]

$E_{1\text{cm}}^{1\%}$ (282nm)：36.5 [本品のエタノール(99.5)溶液(1→10000)]

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「ベタキソロール塩酸塩」の確認試験による

4. 有効成分の定量法

日局「ベタキソロール塩酸塩」の定量法による

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	ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」			ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」								
剤形の区別	フィルムコーティング錠											
性状	白色のフィルムコーティング錠(割線入り)											
識別 コード	本体	Tw246			Tw244							
	包装											
外形	表		裏		側面		表		裏		側面	
	錠径(mm)	5.6			7.1							
厚さ(mm)	2.5			3.2								
質量(mg)	64			126								

(2) 製剤の物性

製品名	ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」	ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」
硬度	4.6kg 重	8.9kg 重

(3) 識別コード

(1) 剤形の区別、外観及び性状の項を参照

(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

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」

1 錠中 日局 ベタキソロール塩酸塩 5mg を含有する。

ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」

1 錠中 日局 ベタキソロール塩酸塩 10mg を含有する。

(2) 添加物

使用目的	添加物
賦形剤	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、結晶セルロース
結合剤	ヒドロキシプロピルセルロース
滑沢剤	ステアリン酸 Mg
コーティング剤	ヒプロメロース、マクロゴール 6000、タルク、酸化チタン

(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

(1) 加速試験

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」¹⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	割線入り白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
溶出率(%)	82.0~110.9	99.2~106.5
含量(%)	100.1~102.7	101.8~103.6

ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」²⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
崩壊時間(分)	5.7~16.2	5.0~14.9
含量(%)	98.7~99.8	99.7~101.0

(2) 長期保存試験

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「トーワ」³⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：25℃、60%RH、3 ロット(n=1)

試験項目	開始時	5年6箇月
性状	割線入り白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	95~103	70~102*
含量(%)	100~102	100~103

*：12錠中10錠以上の個々の溶出率が規定する値であり、適合した。(1ロット n=1)

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度 60%、5年6箇月)の結果、ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「トーワ」は通常の市場流通下において5年間安定であることが確認された。

ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」⁴⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：25℃、60%RH、2 ロット(n=1)

試験項目	開始時	5年6箇月
性状	白色のフィルムコーティング錠	同左* ¹
確認試験	適合	同左
溶出率(%)	59~104* ²	90~105
含量(%)	99~102	101

*¹：白色(開始時)→白色(4年6箇月)→わずかに黄みがかっていた(規格内、5年6箇月)(1ロット)

*²：12錠中10錠以上の個々の溶出率が規定する値であり、適合した。(1ロット n=1)

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：25℃、60%RH、1 ロット(n=1)

試験項目	開始時	6年
性状	白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
溶出率(%)	100~101	99~103
含量(%)	99	97

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度 60%、5年6箇月及び6年)の結果、ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」は通常の市場流通下において5年間安定であることが確認された。

(3) 無包装状態における安定性

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」⁵⁾

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
外観	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
含量	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
硬度	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出性	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし

注) 「(社)日本病院薬剤師会：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」に準じて試験を実施した。

ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」⁶⁾

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
外観	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
含量	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
硬度	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出性	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし

注) 「(社)日本病院薬剤師会：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」に準じて試験を実施した。

(4) 分割後の安定性

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーフ」⁷⁾

包装形態：開放シャーレに入れたもの

試験条件：25℃、60%RH、遮光保存、1ロット(n=3^{*1})

試験項目		開始時	分割直後	1 箇月	3 箇月
性状	表面	白色	同左	同左	同左
	分割面	—	白色	同左	同左
溶出率(%)		51.5~98.9 ^{*2}	95.3~102.4	97.7~102.2	97.7~101.0
含量(%)		99.2	100.3	100.0	99.8

*1：溶出率のみ n=1 で実施したデータ

*2：12 錠中 10 錠以上の個々の溶出率が規定する値であり、適合した。(1ロット n=1)

包装形態：開放シャーレに入れたもの

試験条件：25℃、75%RH、遮光保存、1ロット(n=3^{*1})

試験項目		開始時	分割直後	1 箇月
性状	表面	白色	同左	同左
	分割面	—	白色	同左
溶出率(%)		51.5~98.9 ^{*2}	95.3~102.4	97.9~102.0
含量(%)		99.2	100.3	99.7

*1：溶出率のみ n=1 で実施したデータ

*2：12 錠中 10 錠以上の個々の溶出率が規定する値であり、適合した。(1ロット n=1)

包装形態：シャーレに入れラップで蓋をしたもの

試験条件：25℃、60%RH、3000lx、1ロット(n=3^{*1})

試験項目		開始時	分割直後	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性状	表面	白色	同左	同左	同左
	分割面	—	白色	同左	同左
溶出率(%)		51.5~98.9 ^{*2}	95.3~102.4	94.5~101.3	97.3~101.2
含量(%)		99.2	100.3	98.2	97.4

*1：溶出率のみ n=1 で実施したデータ

*2：12 錠中 10 錠以上の個々の溶出率が規定する値であり、適合した。(1ロット n=1)

ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」⁸⁾

包装形態：開放シャーレに入れたもの

試験条件：25℃、60%RH、遮光保存、1ロット(n=3*)

試験項目		開始時	分割直後	1 箇月	3 箇月
性状	表面	白色	同左	同左	同左
	分割面	—	白色	同左	同左
溶出率(%)		101.4~103.4	92.7~102.6	86.6~104.6	100.3~102.5
含量(%)		100.4	101.4	101.6	101.3

*：溶出率のみ n=1 で実施したデータ

包装形態：開放シャーレに入れたもの

試験条件：25℃、75%RH、遮光保存、1ロット(n=3*)

試験項目		開始時	分割直後	1 箇月
性状	表面	白色	同左	同左
	分割面	—	白色	同左
溶出率(%)		101.4~103.4	92.7~102.6	94.6~103.0
含量(%)		100.4	101.4	101.5

*：溶出率のみ n=1 で実施したデータ

包装形態：シャーレに入れラップで蓋をしたもの

試験条件：25℃、60%RH、3000lx 散光下、1ロット(n=3*1)

試験項目		開始時	分割直後	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性状	表面	白色	同左	同左	同左
	分割面	—	白色	同左	同左
溶出率(%)		101.4~103.4	92.7~102.6	82.3~103.1*2	99.8~102.2
含量(%)		100.4	101.4	100.3	98.4

*1：溶出率のみ n=1 で実施した試験

*2：12 錠中 10 錠以上の個々の溶出率が規定する値であり、適合した。(1ロット n=1)

分割後の安定性試験 (25℃・相対湿度 60%・遮光保存(3 箇月)、25℃・相対湿度 75%・遮光保存(1 箇月)及び 25℃・相対湿度 60%(120 万 lx・hr)の結果、ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」及びベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」はそれぞれの試験項目で、ほとんど変化を認めなかった。

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)

該当しない

7. 溶出性

(1) 規格及び試験方法⁹⁾¹⁰⁾

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「トーワ」及びベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたベタキソロール塩酸塩錠の溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法)

試験液：崩壊試験法第 1 液 900mL

回転数：50rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：15 分間の溶出率が 80%以上のときは適合とする。

〔出典：日本薬局方外医薬品規格第 3 部〕

(2) 品質再評価

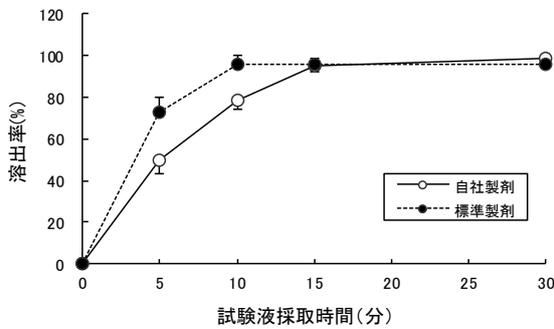
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」¹¹⁾

ベタキソロール塩酸塩錠5mg「トーワ」の溶出試験

ベタキソロール塩酸塩錠5mg「トーワ」につき、標準製剤を用いて、品質再評価(第26次)で指定された下記4種の試験液を用いて溶出試験を行った。

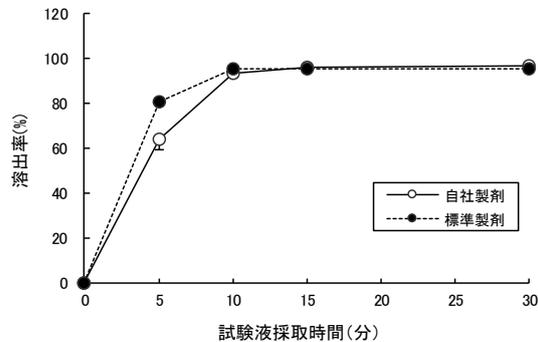
名称	販売名	ベタキソロール塩酸塩錠5mg「トーワ」		
	有効成分名	ベタキソロール塩酸塩		
剤形	錠剤	含量	5mg	
	回転数	50rpm		
溶出試験条件	界面活性剤	なし		
	試験液	① pH1.2 : 日本薬局方崩壊試験の第1液 ② pH4.0 : 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液(0.05mol/L) ③ pH6.8 : 日本薬局方試薬・試液のリン酸塩緩衝液(1→2) ④ 水 : 日本薬局方精製水		

① pH1.2



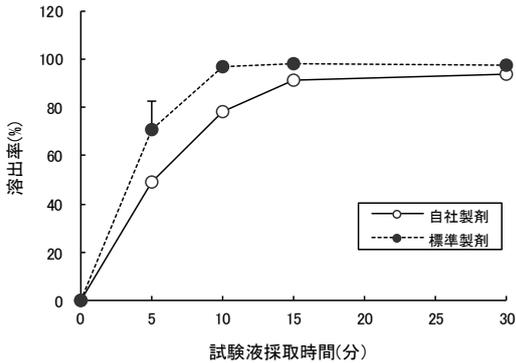
pH1.2	0分	5分	10分	15分	30分
自社製剤	0	49.8	78.2	94.8	98.7
標準製剤	0	73.0	95.9	96.1	95.8

② pH4.0



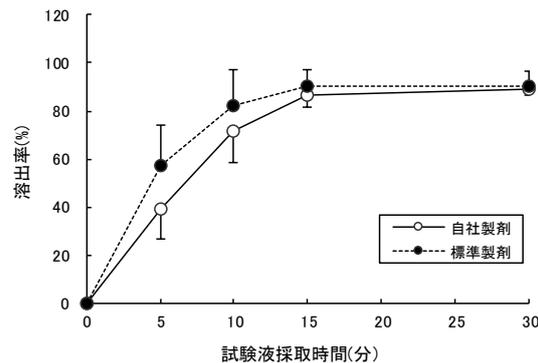
pH4.0	0分	5分	10分	15分	30分
自社製剤	0	64.1	93.4	96.2	96.8
標準製剤	0	80.6	95.6	95.6	95.7

③ pH6.8



pH6.8	0分	5分	10分	15分	30分
自社製剤	0	49.0	78.5	91.1	93.9
標準製剤	0	70.8	96.9	97.9	97.6

④ 水



水	0分	5分	10分	15分	30分
自社製剤	0	39.1	71.3	86.8	89.3
標準製剤	0	57.3	82.3	90.0	90.3

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに従い、自社製剤と標準製剤の4種の試験液における溶出挙動の同等性を判定した結果、自社製剤と標準製剤は同等であると判定された。

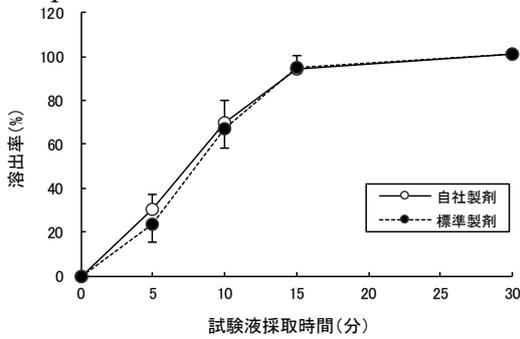
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」¹²⁾

ベタキソロール塩酸塩錠10mg「トーワ」の溶出試験

ベタキソロール塩酸塩錠10mg「トーワ」につき、標準製剤を用いて、品質再評価(第26次)で指定された下記4種の試験液を用いて溶出試験を行った。

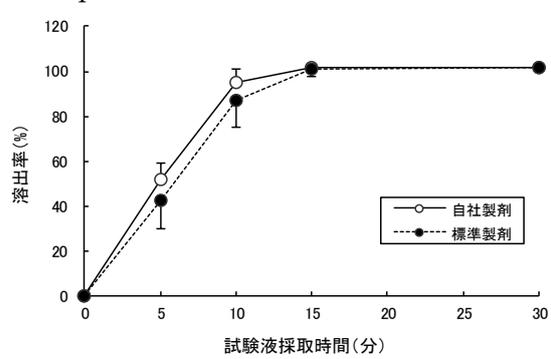
名称	販売名	ベタキソロール塩酸塩錠10mg「トーワ」		
	有効成分名	ベタキソロール塩酸塩		
剤形	錠剤	含量	10mg	
溶出試験条件	回転数	50rpm		
	界面活性剤	なし		
試験液	① pH1.2	: 日本薬局方崩壊試験の第1液		
	② pH4.0	: 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液(0.05mol/L)		
	③ pH6.8	: 日本薬局方試薬・試液のリン酸塩緩衝液(1→2)		
	④ 水	: 日本薬局方精製水		

① pH1.2



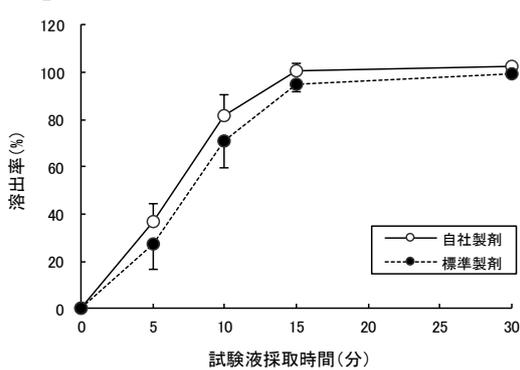
pH1.2	0分	5分	10分	15分	30分
自社製剤	0	30.4	69.6	94.4	101.4
標準製剤	0	23.6	67.3	94.9	100.8

② pH4.0



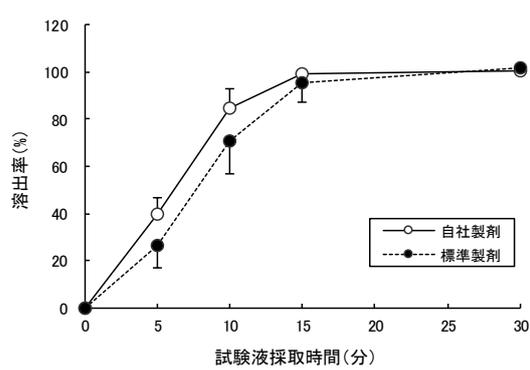
pH4.0	0分	5分	10分	15分	30分
自社製剤	0	51.8	95.3	101.4	101.7
標準製剤	0	42.7	86.8	100.9	102.0

③ pH6.8



pH6.8	0分	5分	10分	15分	30分
自社製剤	0	36.7	81.9	100.9	102.5
標準製剤	0	27.5	71.2	95.1	99.5

④ 水



水	0分	5分	10分	15分	30分
自社製剤	0	39.8	84.8	99.2	100.3
標準製剤	0	26.7	71.0	95.3	101.6

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに従い、自社製剤と標準製剤の4種の試験液における溶出挙動の同等性を判定した結果、自社製剤と標準製剤は同等であると判定された。

(3) 生物学的同等性試験

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」¹³⁾

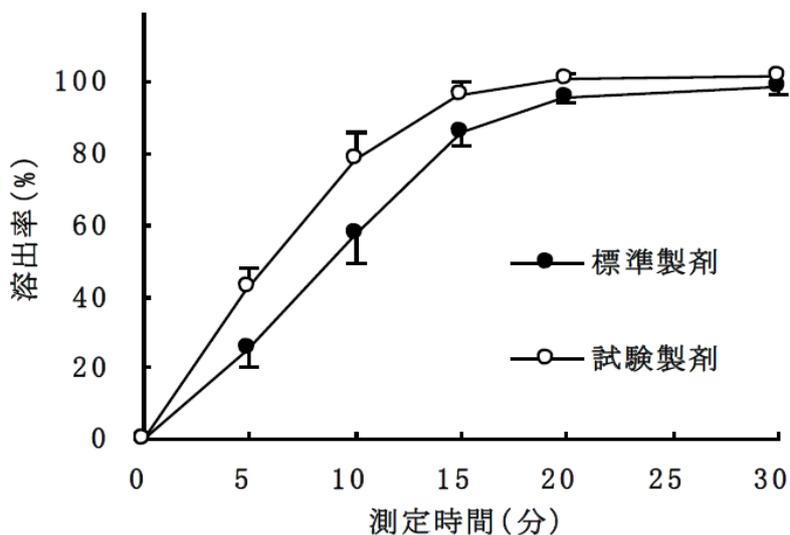
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「トーワ」 (以下、試験製剤) は 1 錠中ベタキソロール塩酸塩 5mg を含有する製剤である。試験製剤の医薬品製造承認申請にあたり、ヒトでの生物学的同等性が確認されたベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」 (以下、標準製剤) を標準製剤に用いて、平成 12 年 2 月 14 日 医薬審第 64 号「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(以下、ガイドライン) に従い、溶出試験を実施し生物学的同等性試験とした。

試験製剤の処方変更水準は、ガイドラインにより A 水準 (標準製剤に対して全ての成分の組成比が等しい) に該当した。また、標準製剤の規格及び試験方法に溶出試験が設定されていることから、当該試験条件で実施した。

試験の結果、試験製剤と標準製剤はいずれも 15 分以内に 85%以上の溶出率を示し、また、最終比較時点の 15 分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なかったため、試験製剤は標準製剤と同等であると判断した。

測定条件

試験法	試験回数	回転数	試験液	試験液量	試験温度	サンプリング時間
パドル法	n=12	50rpm	pH1.2	900mL	37°C	5,10,15,20 及び 30 分



各時間における溶出率 (%)

	5 分	10 分	15 分	20 分	30 分
試験製剤 (2 錠)	42.4 \pm 5.52	78.8 \pm 7.56	96.9 \pm 3.20	101.0 \pm 1.17	101.5 \pm 0.66
標準製剤 (1 錠)	25.6 \pm 5.46	57.8 \pm 8.16	86.2 \pm 3.76	95.9 \pm 1.66	98.5 \pm 1.90

(Mean \pm S.D., 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

(1) ドラーゲンドルフ試液による呈色反応

(2) 紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

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・効果

- ・本態性高血圧症（軽症～中等症）
- ・腎実質性高血圧症
- ・狭心症

2. 用法・用量

本態性高血圧症（軽症～中等症）：

通常、成人にはベタキソロール塩酸塩として5～10 mgを1日1回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減できるが、最高用量は1日1回20 mgまでとする。

腎実質性高血圧症：

通常、成人にはベタキソロール塩酸塩として5 mgを1日1回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減できるが、最高用量は1日1回10 mgまでとする。

狭心症：

通常、成人にはベタキソロール塩酸塩として10 mgを1日1回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減できるが、最高用量は1日1回20 mgまでとする。

【用法・用量に関連する使用上の注意】

褐色細胞腫の患者では、本剤の単独投与により急激に血圧が上昇するおそれがあるので、 α 遮断剤で初期治療を行った後に本剤を投与し、常に α 遮断剤を併用すること。

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

メトプロロール酒石酸塩、アテノロール、ビソプロロールフマル酸塩、セリプロロール塩酸塩などの β_1 遮断薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

アドレナリン β_1 受容体の選択的遮断薬。主として心臓での β_1 受容体刺激効果を抑制する。降圧作用の主たる機序は、 β_1 受容体遮断作用に起因する心拍出量減少とレニン分泌の抑制と考えられている。内因性交感神経興奮様作用はない。

(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

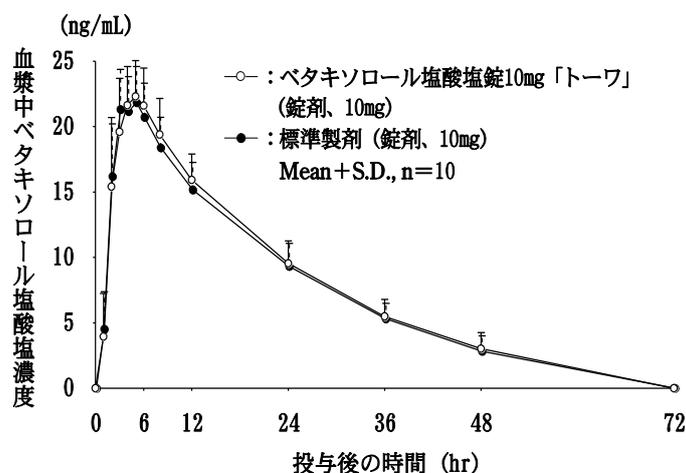
(3) 臨床試験で確認された血中濃度の項を参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験

ベタキシロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」¹⁴⁾

ベタキシロール塩酸塩錠10mg「トーワ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ベタキシロール塩酸塩として10mg）健康成人男子（n=10）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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₇₂ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ベタキシロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」 (錠剤、10mg)	535.36 ± 87.54	22.532 ± 2.833	4.8 ± 0.6	15.225 ± 1.694
標準製剤 (錠剤、10mg)	518.88 ± 84.70	22.334 ± 2.896	4.3 ± 0.9	14.665 ± 1.923

(Mean ± S.D., n=10)

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

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

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¹⁴⁾

ベタキシロール塩酸塩錠 10mg 「トーワ」

kel : $0.04611 \pm 0.00593 \text{hr}^{-1}$ (健康成人男子、絶食経口投与)

(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

3. 吸 収

該当資料なし

4. 分 布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

VIII. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与の項 1)を参照

(3) 乳汁への移行性

VIII. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与の項 2)を参照

(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

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(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

VIII. 13. 過量投与の項を参照

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)】

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) 糖尿病性ケトアシドーシス、代謝性アシドーシスのある患者 [アシドーシスに基づく心収縮力の抑制を増強させるおそれがある。]
- 3) 高度の徐脈(著しい洞性徐脈)、房室ブロック(Ⅱ、Ⅲ度)、洞房ブロックのある患者 [症状を悪化させるおそれがある。]
- 4) 心原性ショックのある患者 [心機能を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。]
- 5) 肺高血圧による右心不全のある患者 [心機能を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。]
- 6) うっ血性心不全のある患者 [心機能を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。]
- 7) 未治療の褐色細胞腫の患者 (「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照)
- 8) 妊婦又は妊娠している可能性のある女性 (「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

3. 効能・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・用量に関連する使用上の注意とその理由

【用法・用量に関連する使用上の注意】

褐色細胞腫の患者では、本剤の単独投与により急激に血圧が上昇するおそれがあるため、 α 遮断剤で初期治療を行った後に本剤を投与し、常に α 遮断剤を併用すること。

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)

- 1) 気管支喘息、気管支痙攣のおそれのある患者 [症状を惹起するおそれがあるため、観察を十分に行い、慎重に投与すること。]
- 2) うっ血性心不全のおそれのある患者 [心機能を抑制し、症状を悪化させるおそれがあるため、観察を十分に行い、ジギタリス剤を併用するなど慎重に投与すること。]
- 3) 甲状腺中毒症の患者 [症状(頻脈等)をマスクするおそれがある。] (「重要な基本的注意」の項参照)
- 4) 特発性低血糖症、コントロール不十分な糖尿病、長期間絶食状態の患者 [低血糖の前駆症状である頻脈等の交感神経系反応をマスクしやすいので、血糖値に注意すること。]
- 5) 重篤な肝機能障害のある患者 [本剤の代謝又は排泄が遅延するおそれがある。]
- 6) 重篤な腎機能障害のある患者 [本剤の代謝又は排泄が遅延するおそれがある。]
- 7) レイノー症候群、間欠性跛行症等の末梢循環障害のある患者 [末梢循環障害が増悪するおそれがある。]
- 8) 徐脈、房室ブロック(Ⅰ度)のある患者 [心刺激伝導系を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。]
- 9) 高齢者 (「高齢者への投与」の項参照)

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) 投与が長期にわたる場合は、心機能検査(脈拍・血圧・心電図・X線等)を定期的に行うこと。徐脈又は低血圧の症状があらわれた場合には、減量又は中止すること。
また、必要に応じてアトロピンを使用すること。
なお、肝機能、腎機能、血液像等に注意すること。
- 2) 類似化合物(プロプラノロール塩酸塩)使用中の狭心症の患者で急に投与を中止したとき、症状が悪化したり、心筋梗塞を起こした症例が報告されているので、休薬を要する場合は徐々に減量し、観察を十分に行うこと。また、患者に医師の指示なしに服薬を中止しないよう注意すること。狭心症以外の適用、例えば高血圧で投与する場合でも、特に高齢者においては同様の注意をすること。
- 3) 甲状腺中毒症の患者では急に投与を中止すると、症状を悪化させることがあるので、休薬を要する場合には徐々に減量し、観察を十分に行うこと。
- 4) 手術前48時間は投与しないことが望ましい。
- 5) 降圧作用に基づくめまい等があらわれることがあるので高所作業、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。

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

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
交感神経抑制剤 レセルピン 等	過剰の交感神経抑制を来すことがあるので、減量するなど注意する。	相加的に作用(交感神経抑制作用)を増強させる。
血糖降下剤 インスリン トルブタミド アセトヘキサミド 等	血糖降下作用を増強すること がある。また、低血糖状態(頻脈、発汗等)をマスクすること があるので、血糖値に注意す る。	低血糖に伴う交感神経系の症 状をマスクしたり、β遮断作用 により低血糖の回復を遅らせ る。
カルシウム拮抗剤 ベラパミル塩酸塩 ジルチアゼム塩酸塩 等	徐脈、房室ブロック等の伝導障 害、うっ血性心不全があらわれ ることがある。併用する場合 には、用量に注意する。	相加的に作用(陰性変力作用、 心刺激伝導抑制作用、降圧作 用)を増強させる。

クロニジン	クロニジン投与中止後のリバウンド現象を増強するおそれがある。β遮断剤を先に中止し、クロニジンを徐々に減量する。	クロニジンはα ₂ 受容体を選択的に作用し、ノルアドレナリンの遊離を抑制しているため、急激な中止によって、血中カテコールアミンの上昇が起こる。この時β遮断剤を併用すると、上昇したカテコールアミンの作用のうち、β受容体刺激作用が遮断され、α受容体刺激作用だけが残り、急激な血圧上昇が起こる。
クラスⅠ抗不整脈剤 ジソピラミド プロカインアミド塩酸塩 アジマリン 等 アミオダロン塩酸塩	過度の心機能抑制があらわれることがあるので、減量するなど注意する。	相加的に作用(心機能抑制作用)を増強させる。
麻酔剤 エーテル 等	過剰の交感神経抑制を来すおそれがあるので、減量するなど注意する。	相加的に作用(交感神経抑制作用)を増強させる。
ジギタリス製剤	心刺激伝導障害(徐脈、房室ブロック等)があらわれることがあるので、心機能に注意する。	相加的に作用(心刺激伝導抑制作用)を増強させる。
非ステロイド性抗炎症剤 インドメタシン 等	本剤の降圧作用が減弱することがある。	非ステロイド性抗炎症剤は、血管拡張作用を有するプロスタグランジンの合成を阻害し、血圧を上昇させることがある。
降圧作用を有する他の薬剤	降圧作用を増強することがあるので、減量するなど適切な処置を行うこと。	相加的に降圧作用を増強させる。
レミフェンタニル塩酸塩	徐脈、血圧低下等の作用が増強することがあるので、減量するなど注意すること。	併用により作用(心機能抑制作用)を増強させる。
フィンゴリモド塩酸塩	フィンゴリモド塩酸塩の投与開始時に本剤を併用すると重度の徐脈や心ブロックが認められることがある。	共に徐脈や心ブロックを引き起こすおそれがある。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（頻度不明）

完全房室ブロック、心胸比増大、心不全：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) その他の副作用

その他の副作用	
	頻度不明
循環器	レイノー現象、洞停止、徐脈、低血圧、動悸、胸痛、心電図異常、房室ブロック
眼	涙液分泌減少 ^{注2)} 、霧視(感) ^{注2)} 、目のちらつき
過敏症 ^{注3)}	発疹、蕁麻疹、そう痒
精神神経系	ふらふら感、頭痛、めまい、ぼんやり、眠気、不眠、幻覚、悪夢、蟻走感、うつ状態
消化器	下痢、嘔吐、口渇、悪心、胃部不快感、胃痛
肝臓	肝機能障害 (AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、Al-P 上昇、 γ -GTP 上昇、LDH 上昇等)
呼吸器	呼吸困難、喘息症状
腎臓	BUN 上昇
その他	けん怠感、浮腫、尿酸値上昇、中性脂肪上昇、コレステロール上昇、高血糖、CK (CPK) 上昇、HDL-コレステロール低下、疲労感、しびれ感、脱力感、耳鳴、熱感、発汗、インポテンス

注2) 他の β 遮断剤で報告されている。

注3) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

(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

添付文書より抜粋

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- 1) 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 ^{注3)}	発疹、蕁麻疹、そう痒

注3) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

9. 高齢者への投与

高齢者への投与

高齢者に使用する場合は、低用量(例えば高血圧症では2.5 mg、狭心症では5 mg)から投与を開始するなど、経過を十分観察しながら慎重に投与することが望ましい。[一般的に高齢者では、過度の降圧は好ましくないとされている。]

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女性には投与しないこと。[動物実験(ラット)で、胚・胎児の死亡の増加が報告されている。]
- 2) 投与中は授乳を避けさせること。[動物実験(ラット)で、乳汁中へ移行することが報告されている。]

11. 小児等への投与

小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。(使用経験がない)

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 過量投与

過量投与

症状：本剤の過量投与時に予測される症状は、低血圧、徐脈、心不全、気管支痙攣、房室ブロック、低血糖等である。

処置：本剤の投与を中止し、患者を慎重に観察すること。胃洗浄のほかに必要に応じて適切な処置を行う。血液透析又は腹膜透析では本剤を十分に除去することはできない。

- 1) **低血圧**：交感神経刺激作用のあるドパミン、ドブタミン、ノルアドレナリン等の昇圧剤を投与する。別のβ遮断剤の過量投与例においてグルカゴンが有効であったとの報告がある。
- 2) **徐脈**：アトロピン硫酸塩水和物を投与し、更に必要に応じてβ₁刺激剤であるドブタミンを投与する。迷走神経遮断に対して反応のない場合にはイソプロテレノールを慎重に投与する。それでも効果のみられない場合、経静脈ペースメーカーを考慮する。グルカゴンが

有効であったとの報告もある。

- 3) 急性心不全：直ちにジギタリス、利尿剤、酸素吸入などの標準的治療を開始すること。
- 4) 気管支痙攣： β_2 作動薬を用いること。ほかに、アミノフィリンの投与を検討する。
- 5) 房室ブロック(Ⅱ度又はⅢ度)：イソプロテレノール又は心臓ペースメーカーを用いる。
- 6) 低血糖：ブドウ糖を投与する。

14. 適用上の注意

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。]

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

該当資料なし

(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：処方箋医薬品^{注)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：5年(外箱に記載)

3. 貯法・保存条件

貯法：室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

VIII. 14. 適用上の注意の項を参照

(2) 薬剤交付時の取扱いについて

患者向け医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

(3) 調剤時の留意点について

VIII. 14. 適用上の注意の項を参照

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

製品名	包装形態	内容量(重量、容量又は個数等)
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「トーワ」	PTP包装	100錠、500錠
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」	PTP包装	100錠、500錠

7. 容器の材質

製品名	包装形態	材質
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「トーワ」	PTP包装	PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」	PTP包装	PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ケルロング錠 5mg、ケルロング錠 10mg

同効薬： β_1 遮断薬

メトプロロール酒石酸塩、アテノロール、ビソプロロールフマル酸塩、
セリプロロール塩酸塩 等

9. 国際誕生年月日

1982年5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	備考
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「トーワ」	2004年2月24日	21600AMZ00282000	
	2017年2月1日	22900AMX00090000	販売名変更による
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」	2002年3月14日	21400AMZ00367000	
	2004年2月24日	21600AMZ00288000	販売名変更による
	2017年2月1日	22900AMX00091000	販売名変更による

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日	備考
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「トーワ」	2004年7月9日	
	2017年6月16日	販売名変更による
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」	2002年7月5日	
	2004年7月9日	販売名変更による
	2017年6月16日	販売名変更による

12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

製品名	HOT 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
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「トーワ」	116338401	2149031F1019 (統一名) 2149031F1094 (個別)	622725100 (統一名) 621633801 (個別)
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「トーワ」	114699801	2149031F2104	621469901

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) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(錠 5mg)
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(錠 10mg)
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：長期保存試験(錠 5mg)
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：長期保存試験(錠 10mg)
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(錠 5mg)
- 6) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(錠 10mg)
- 7) 東和薬品株式会社 社内資料：分割後の安定性試験(錠 5mg)
- 8) 東和薬品株式会社 社内資料：分割後の安定性試験(錠 10mg)
- 9) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(錠 5mg)
- 10) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(錠 10mg)
- 11) 東和薬品株式会社 社内資料：品質再評価；溶出試験(錠 5mg)
- 12) 東和薬品株式会社 社内資料：品質再評価；溶出試験(錠 10mg)
- 13) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 14) 陶 易王ほか：医学と薬学, 49(2), 251, 2003

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

東和薬品株式会社 製品情報ホームページ

<https://med.towayakuhin.co.jp/medical/product/index.php>

製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号