2025年6月改訂（第6版）　　日本標準商品分類番号：87449

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H_1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「トーワ」
ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「トーワ」

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「トーワ」
ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「トーワ」

BEPOTASTINE BESILATE TABLETS 5mg “TOWA” / TABLETS 10mg “TOWA” /
OD TABLETS 5mg “TOWA” / OD TABLETS 10mg “TOWA”

販売名	ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「トーワ」
剤形	フィルムコーティング錠		口腔内崩壊錠	
製剤の規制区分	該当しない			
規格・含量	1錠中 日局 ベポタスチンベシル酸塩 5mg含有	1錠中 日局 ベポタスチンベシル酸塩 10mg含有	1錠中 日局 ベポタスチンベシル酸塩 5mg含有	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・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2012年　8月　15日 薬価基準収載年月日：2018年　6月　15日 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：　東和薬品株式会社			
医薬情報担当者の連絡先				
問い合わせ窓口	東和薬品株式会社　学術部DIセンター TEL　0120-108-932　　FAX　06-7177-7379 https://med.towayakuhin.co.jp/medical/			

本IFは2025年5月改訂の電子添文の記載に基づき作成した。
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、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
1．開発の経緯 ……1
2．製品の治療学的特性 ……1
3．製品の製剤学的特性 ……1
4．適正使用に関して周知すべき特性 ……1
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項 ……1
6．RMP の概要 ……1

Ⅱ. 名称に関する項目 ……2
1．販売名 ……2
2．一般名 ……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）又は本質 ……2
6．慣用名、別名、略号、記号番号 ……2

Ⅲ. 有効成分に関する項目 ……3
1．物理化学的性質 ……3
2．有効成分の各種条件下における安定性 ……3
3．有効成分の確認試験法、定量法 ……3

Ⅳ. 製剤に関する項目 ……4
1．剤形 ……4
2．製剤の組成 ……5
3．添付溶解液の組成及び容量 ……5
4．力価 ……5
5．混入する可能性のある夾雑物 ……5
6．製剤の各種条件下における安定性 ……6
7．調製法及び溶解後の安定性 ……9
8．他剤との配合変化（物理化学的変化） ……10
9．溶出性 ……10
10．容器・包装 ……18
11．別途提供される資材類 ……18
12．その他 ……18

Ⅴ. 治療に関する項目 ……19
1．効能又は効果 ……19
2．効能又は効果に関連する注意 ……19
3．用法及び用量 ……19
4．用法及び用量に関連する注意 ……19
5．臨床成績 ……19

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 ……23
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ……23
2．薬理作用 ……23

Ⅶ. 薬物動態に関する項目 ……24
1．血中濃度の推移 ……24
2．薬物速度論的パラメータ ……26
3．母集団（ポピュレーション）解析 ……27
4．吸収 ……27
5．分布 ……27
6．代謝 ……28
7．排泄 ……28
8．トランスポーターに関する情報 ……28
9．透析等による除去率 ……28
10．特定の背景を有する患者 ……28
11．その他 ……29

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 ……30
1．警告内容とその理由 ……30
2．禁忌内容とその理由 ……30
3．効能又は効果に関連する注意とその理由 ……30
4．用法及び用量に関連する注意とその理由 ……30
5．重要な基本的注意とその理由 ……30
6．特定の背景を有する患者に関する注意 ……30
7．相互作用 ……31
8．副作用 ……31
9．臨床検査結果に及ぼす影響 ……31
10．過量投与 ……32
11．適用上の注意 ……32
12．その他の注意 ……32

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目 ……33
1．薬理試験 ……33
2．毒性試験 ……33

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 ……34
1．規制区分 ……34
2．有効期間 ……34
3．包装状態での貯法 ……34
4．取扱い上の注意 ……34
5．患者向け資材 ……34
6．同一成分・同効薬 ……34
7．国際誕生年月日 ……34
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 ……34
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 ……35
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 ……35
11．再審査期間 ……35
12．投薬期間制限に関する情報 ……35
13．各種コード ……35
14．保険給付上の注意 ……35

ⅩⅠ. 文献 ……36
1．引用文献 ……36
2．その他の参考文献 ……37

ⅩⅡ. 参考資料 ……37
1．主な外国での発売状況 ……37
2．海外における臨床支援情報 ……37

ⅩⅢ. 備考 ……38
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 ……38
2．その他の関連資料 ……40

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選択的ヒスタミン H_1 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療薬であり、本邦では 2000 年から製造販売されている。

東和薬品株式会社が後発医薬品として､ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg/10mg･OD 錠 5mg/10mg「トーワ」の開発を企画し、薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 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、2012 年 8 月に承認を取得、2018 年 6 月に発売した。

２．製品の治療学的特性

本剤は、ベポタスチンベシル酸塩を有効成分とする選択的ヒスタミン H_1 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤であり「アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症)」の効能又は効果を有する。(「Ⅴ．1．効能又は効果」の項参照)

３．製品の製剤学的特性

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg/10mg「トーワ」

・東和薬品独自の OD 錠製造技術である RACTAB 技術を採用した、水なしでも服用できるペパーミント風味の OD 錠

共通

・錠剤両面に製品名と含量を印刷

・OD 錠 10mg、錠 10mg に割線を付与。分割後の錠剤に「ベポタス 10」の表示が残る
（「Ⅳ．1．(2)製剤の外観及び性状」の項参照）

・PTP シートに薬効［アレルギー性疾患の薬］を表示

・PTP シートをスリットで切り離し後も GS1 コードを表示（裏面)。専用アプリ「添文ナビ」で読み取ることで、最新の電子添文等を参照可能

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、最適使用推進ガイドライン等	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

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

１．販売名

(1) 和　　名

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

(2) 洋　　名

BEPOTASTINE BESILATE TABLETS 5mg“TOWA”
BEPOTASTINE BESILATE TABLETS 10mg“TOWA”
BEPOTASTINE BESILATE OD TABLETS 5mg“TOWA”
BEPOTASTINE BESILATE OD TABLETS 10mg“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）

ベポタスチンベシル酸塩（JAN）

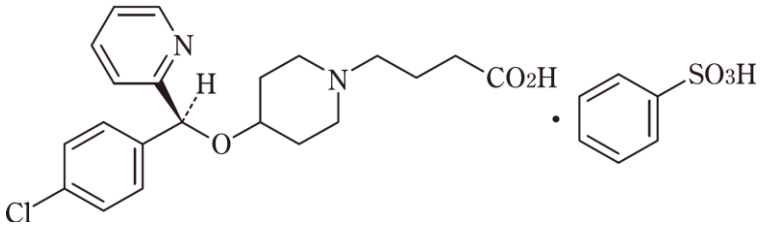
(2) 洋　　名（命名法）

bepotastine besilate（JAN）
bepotastine（INN）

(3) ステム

抗ヒスタミン薬：-astine

３．構造式又は示性式



４．分子式及び分子量

分子式：$C_{21}H_{25}ClN_2O_3$・$C_6H_6O_3S$
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

該当資料なし

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

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：159～163℃

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

1g を水 100mL に溶かした液の pH は約 3.8 である。

２．有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

３．有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

日局「ベポタスチンベシル酸塩」の確認試験による

定量法

日局「ベポタスチンベシル酸塩」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

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg/10mg「トーワ」: 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/10mg「トーワ」: 口腔内崩壊錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名		ベポタスチンベシル酸塩 錠 5mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩 錠 10mg「トーワ」
性状・剤形		白色のフィルムコーティング錠	白色の割線入りの フィルムコーティング錠
本体表示	表	ベポタスチン 5 トーワ	ベポタス 10
	裏		ベポタスチン 10 トーワ
外形	表		
	裏		
	側面		
直径(mm)		6.0	7.1
厚さ(mm)		2.9	3.2
質量(mg)		93	139

販売名		ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」
性状・剤形		白色の口腔内崩壊錠	白色の割線入りの口腔内崩壊錠
本体表示	表	ベポタスチン 5 OD トーワ	ベポタス 10
	裏		ベポタスチン 10 OD トーワ
外形	表		
	裏		
	側面		
直径(mm)		7.0	9.0
厚さ(mm)		3.4	4.2
質量(mg)		135	270

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

販売名	ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「トーワ」
硬度	94N	115N	56N	98N
摩損度			0.03%	0.07%

(5) その他

該当しない

2．製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「トーワ」
1錠中の有効成分	日局 ベポタスチンベシル酸塩 5mg	日局 ベポタスチンベシル酸塩 10mg
添加剤	D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、タルク	

販売名	ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「トーワ」	ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「トーワ」
1錠中の有効成分	日局 ベポタスチンベシル酸 5mg	日局 ベポタスチンベシル酸塩 10mg
添加剤	D-マンニトール、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、タルク、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、l-メントール、香料、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、その他3成分	

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

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

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「トーワ」

(1) 加速試験 [39]

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品(乾燥剤入り)
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	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	81.7～104.7*	82.3～104.5*
含量(%)	100.1～101.6	99.9～102.0

＊：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加速試験(40℃、相対湿度 75%、6 箇月)の結果、ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「トーワ」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。

(2) 無包装状態における安定性 [40]

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (120 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。

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」

(1) 加速試験 [41]

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品(乾燥剤入り)
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	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	88.6～104.8	82.4～103.5*
含量(%)	99.8～101.0	99.2～100.9

＊：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：ポリエチレン瓶に入れた製品(乾燥剤入り)
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	白色の割線入りの フィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	88.6～104.8	81.5～103.5*
含量(%)	99.8～101.0	98.6～100.8

＊：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))

(2) 長期保存試験 [42]

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品(乾燥剤入り)
試験条件：25℃、60%RH、3 ロット(n=1)

試験項目	開始時	4 年 6 箇月
性状	白色の割線入りの フィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	94.5～100.3	97.1～105.7
含量(%)	99.4～100.2	98.8～99.9

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品(乾燥剤入り)
試験条件：25℃、60%RH、1 ロット(n=1)

試験項目	開始時	4 年 6 箇月
性状	白色の割線入りの フィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	94.5～99.1	99.7～101.6
含量(%)	99.4	99.0

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度 60%、4 年 6 箇月)の結果、ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」は通常の市場流通下において 4 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 [43]

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (120 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 [44]

保存形態：シャーレ（ラップで覆う）
試験条件：成り行き温湿度（22.5～25.9℃、29～66.5%RH）、600lx、1 ロット(n=3)

試験項目		開始時	分割直後	3 箇月
性状	表面	白色	同左	同左
	分割面	－	白色	同左
含量(%)		100.0	100.4	100.2

分割後の安定性試験(成り行き温湿度、600lx、3 箇月)の結果、ベポタスチンベシル酸塩錠 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。

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」

(1) 加速試験 [45]

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品(乾燥剤入り)
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	白色の口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
崩壊時間(秒)	17～23	15～21
溶出率(%)	96.2～101.4	96.9～101.3
含量(%)	99.2～100.1	98.8～100.2

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

(2) 無包装状態における安定性 [46]

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (120 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
崩壊性	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。

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」

(1) 加速試験 [47]

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品(乾燥剤入り)
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	白色の割線入りの 口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
崩壊時間(秒)	19～23	16～34
溶出率(%)	95.4～100.1	96.5～101.1
含量(%)	98.4～99.8	98.8～99.6

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品(乾燥剤入り)
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	白色の割線入りの 口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
崩壊時間(秒)	19～23	14～23
溶出率(%)	95.4～100.1	96.5～100.7
含量(%)	98.4～99.8	98.2～99.2

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

(2) 無包装状態における安定性 [48]

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (120 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
崩壊性	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。

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）

服薬補助ゼリーとの配合変化

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」

■方法

(1)配合方法

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」（1 錠）と服薬補助ゼリー（大さじ 1（およそ 15mL））を配合した。

(2)保存条件

条件：成り行き温湿度、室内散光下

保存形態：無色透明ガラス製容器（密栓）

■結果

販売名	服薬補助ゼリー（メーカー名）	測定項目	測定時点		
			配合前	配合直後	3 時間後
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」	らくらく服薬ゼリー（龍角散）	外観	試験製剤：白色の割線入りの口腔内崩壊錠	微黄白色のゼリーに錠剤が包まれていた	微黄白色のゼリーに膨潤した錠剤が包まれていた
		におい		レモン様のにおい	同左
		含量（%）	試験製剤：100.9	100.5	99.1
		残存率（%）		100.0	98.6

９．溶出性

(1) 規格及び試験方法

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg/10mg「トーワ」

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg/10mg「トーワ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたベポタスチンベシル酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

方　法：日局溶出試験法(パドル法)
試験液：水 900mL
回転数：50rpm
測定法：液体クロマトグラフィー
規　格：30 分間の溶出率が 85%以上のときは適合とする。

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg/10mg「トーワ」

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg/10mg「トーワ」は、設定された溶出規格に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：水 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 85%以上のときは適合とする。

(2) 生物学的同等性試験

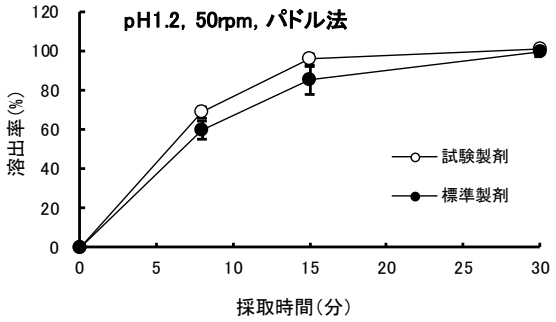
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「トーワ」[10)]

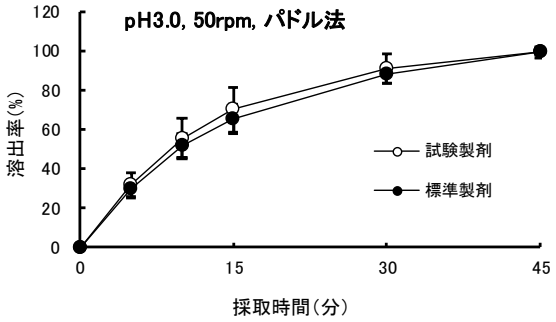
16.8 その他 〈ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「トーワ」〉 ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「トーワ」は、ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等と判断され、生物学的に同等とみなされた。[10)]

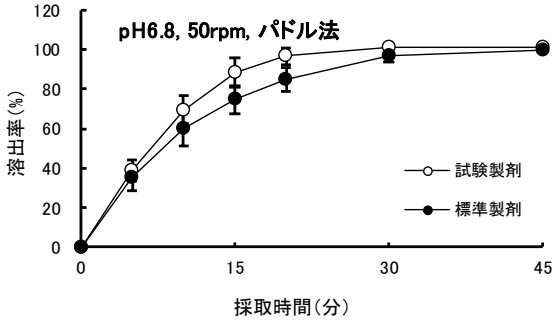
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「トーワ」について、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）（以下、ガイドライン）に従い、ヒトでの生物学的同等性が確認されたベポタスチンベシル酸塩錠 10 mg「トーワ」を標準製剤として溶出試験を行い、生物学的同等性試験とした。なお、試験製剤の処方変更水準は、ガイドラインにより B 水準に該当した。

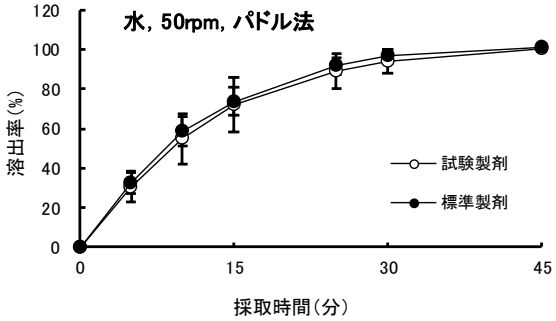
＜測定条件＞

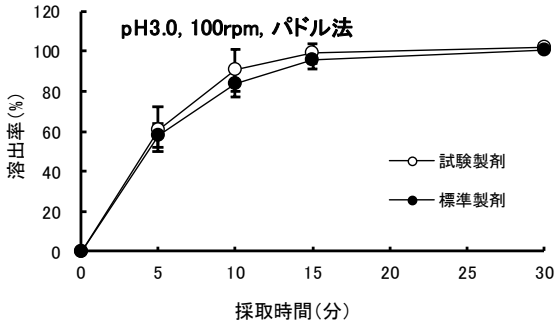
試 験 液	：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水	検 体 数	：n=12
回 転 数	：50rpm、100rpm	試 験 法	：パドル法
試験製剤	：ベポタスチンベシル酸塩錠5mg「トーワ」	標準製剤	：ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「トーワ」











平均溶出率(%)±S.D.

①同等性の判定基準及び判定結果（平均溶出率）

試験条件		判定時間(分)	平均溶出率（%） 試験製剤	平均溶出率（%） 標準製剤	溶出率の差(%)	f_2 値	同等性の判定基準	判定
パドル法 50rpm	pH1.2	15	95.7	85.0			15 分以内に平均 85%以上溶出	適
	pH3.0	15	70.2	65.4	4.8		標準製剤の平均溶出率の±10%以内	適
		30	91.1	88.3	2.8			
	pH6.8	15	88.2	74.6		53.9	f_2 関数の値が 50 以上	適
		30	101.3	96.8				
		45	101.4	100.0				
	水	10	54.9	58.6	-3.7		標準製剤の平均溶出率の±10%以内	適
		25	89.2	91.8	-2.6			
パドル法 100rpm	pH3.0	15	99.0	95.8			15 分以内に平均 85%以上溶出	適

②同等性の判定基準及び判定結果（試験製剤の個々の溶出率）

試験条件		判定時間(分)	(a) 最小値～最大値(%)	(b) 平均溶出率±15%の範囲(%)	(a)が(b)を超えた数	同等性の判定基準	判定
パドル法 50rpm	pH1.2	15	89.8～100.0	80.7～110.7	0	最終比較時点における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	適
	pH3.0	30	76.1～102.5	76.1～106.1	0		適
	pH6.8	45	99.8～102.8	86.4～116.4	0		適
	水	25	75.3～100.0	74.2～104.2	0		適
パドル法 100rpm	pH3.0	15	88.7～104.0	84.0～114.0	0		適

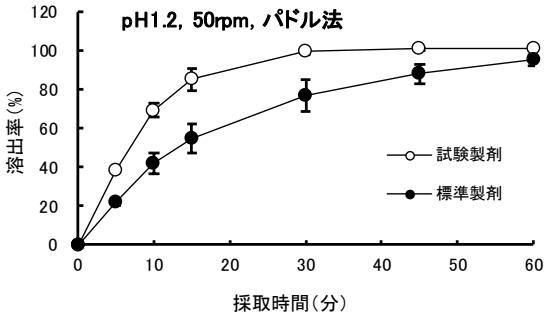
①②の結果より、すべての試験条件で判定基準を満たし、溶出挙動が同等と判定された。
従って、ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「トーワ」と、標準製剤（ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」）は、生物学的に同等とみなされた。

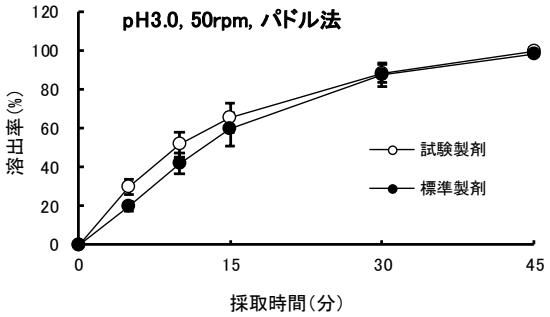
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」[49)]

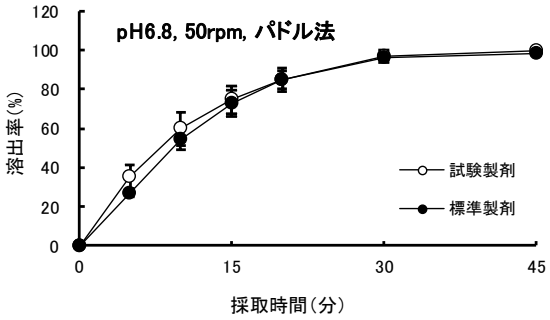
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成 18 年 11 月 24 日薬食審査発第 1124004 号）（以下、ガイドライン）に従い溶出試験を行った。

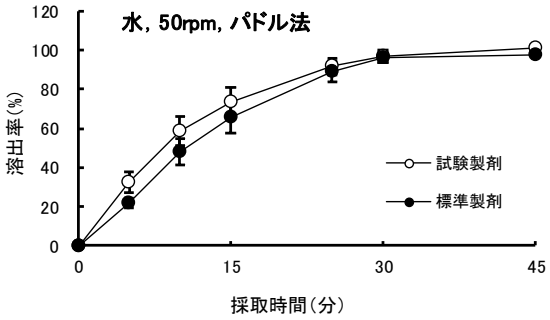
＜測定条件＞

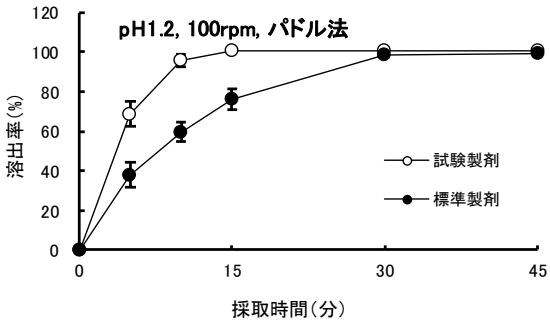
試 験 液	：	pH1.2、pH3.0、pH6.8、水	検 体 数	：	n=12
回 転 数	：	50rpm、100rpm	試 験 法	：	パドル法
試験製剤	：	ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「トーワ」	標準製剤	：	タリオン錠10mg











平均溶出率(%)±S.D.

類似性の判定基準及び判定結果

<table>
<tr><th colspan="2" rowspan="2">試験条件</th><th rowspan="2">判定時間(分)</th><th colspan="2">平均溶出率(%)</th><th rowspan="2">溶出率の差(%)</th><th rowspan="2">f_2 値</th><th rowspan="2">類似性の判定基準</th><th rowspan="2">判定</th></tr>
<tr><th>試験製剤</th><th>標準製剤</th></tr>
<tr><td rowspan="8">パドル法
50rpm</td><td rowspan="2">pH1.2</td><td>10</td><td>69.3</td><td>42.0</td><td>27.3</td><td rowspan="2"></td><td rowspan="8">標準製剤の平均溶出率の±15%以内</td><td rowspan="2">不適</td></tr>
<tr><td>45</td><td>100.8</td><td>88.1</td><td>12.7</td></tr>
<tr><td rowspan="2">pH3.0</td><td>15</td><td>65.4</td><td>59.4</td><td>6.0</td><td rowspan="2"></td><td rowspan="2">適</td></tr>
<tr><td>30</td><td>88.3</td><td>87.6</td><td>0.7</td></tr>
<tr><td rowspan="2">pH6.8</td><td>10</td><td>59.9</td><td>54.6</td><td>5.3</td><td rowspan="2"></td><td rowspan="2">適</td></tr>
<tr><td>20</td><td>85.0</td><td>84.8</td><td>0.2</td></tr>
<tr><td rowspan="2">水</td><td>15</td><td>73.6</td><td>65.7</td><td>7.9</td><td rowspan="2"></td><td rowspan="2">適</td></tr>
<tr><td>25</td><td>91.8</td><td>88.8</td><td>3.0</td></tr>
<tr><td rowspan="3">パドル法
100rpm</td><td rowspan="3">pH1.2</td><td>15</td><td>100.7</td><td>76.1</td><td rowspan="3"></td><td rowspan="3">42.2</td><td rowspan="3">f_2 値が 42 以上</td><td rowspan="3">適</td></tr>
<tr><td>30</td><td>100.8</td><td>98.5</td></tr>
<tr><td>45</td><td>100.7</td><td>98.9</td></tr>
</table>

上記の結果より、pH1.2（50rpm）の試験条件において、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準を満たしておらず、試験製剤及び標準製剤の溶出挙動は類似していないと判断した。なお、いずれの試験条件も標準製剤と試験製剤の溶出率の間に「著しい差」を認めなかったため、ガイドラインに基づいて、健康成人を被験者として生物学的同等性試験を行い、ベポタスチンベシル酸塩錠10mg「トーワ」は標準製剤との生物学的同等性が確認された。

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」[11)]

16.8 その他

〈ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」〉

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」は、ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等と判断され、生物学的に同等とみなされた。[11)]

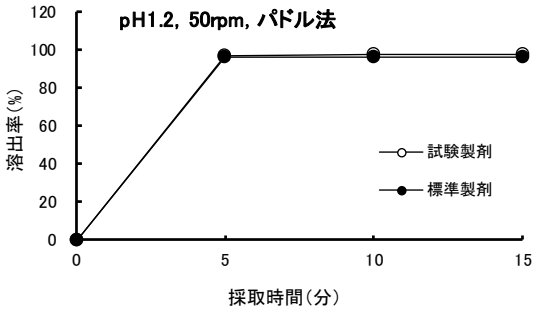
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」について、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 18 年 11 月 24 日薬食審査発第 1124004 号)(以下、ガイドライン)に従い、ヒトでの生物学的同等性が確認されたベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10 mg「トーワ」を標準製剤として溶出試験を行い、生物学的同等性試験とした。なお、試験製剤の処方変更水準は、ガイドラインにより A 水準に該当した。

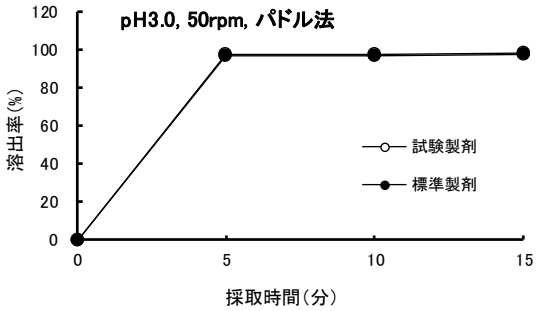
＜測定条件＞

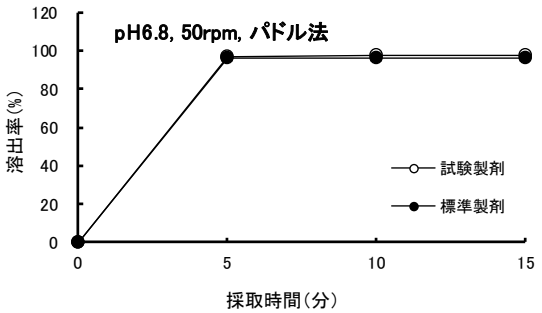
試 験 液　：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水　　検 体 数　：n=12

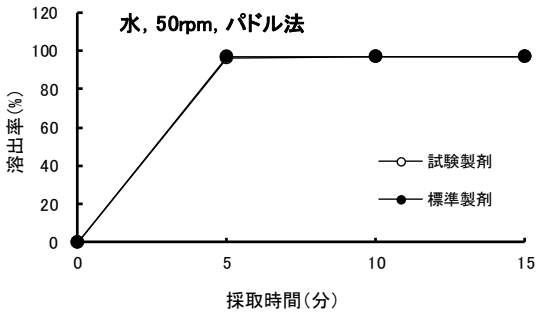
回 転 数　：50rpm、100rpm　　試 験 法　：パドル法

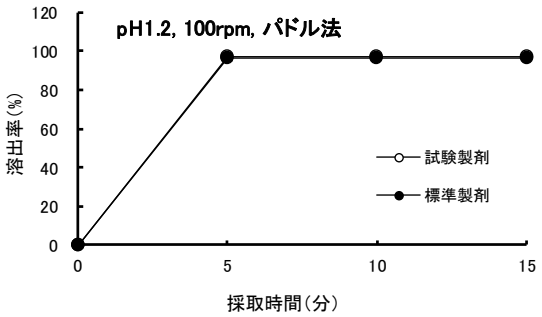
試験製剤　：ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「トーワ」　　標準製剤　：ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「トーワ」











平均溶出率(%)±S.D.

①同等性の判定基準及び判定結果（平均溶出率）

試験条件		判定時間(分)	平均溶出率(%)		同等性の判定基準	判定
			試験製剤	標準製剤		
パドル法 50rpm	pH1.2	15	97.4	95.9	15 分以内に平均 85%以上溶出	適
	pH3.0	15	97.8	97.1		適
	pH6.8	15	97.3	96.2		適
	水	15	96.7	96.8		適
パドル法 100rpm	pH1.2	15	97.2	96.4		適

②同等性の判定基準及び判定結果（試験製剤の個々の溶出率）

試験条件		判定時間(分)	(a) 最小値～最大値(%)	(b) 平均溶出率±15%の範囲(%)	(a)が(b)を超えた数	同等性の判定基準	判定
パドル法 50rpm	pH1.2	15	95.8～99.2	82.4～112.4	0	最終比較時点における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	適
	pH3.0	15	96.3～100.0	82.8～112.8	0		適
	pH6.8	15	95.7～99.2	82.3～112.3	0		適
	水	15	95.9～97.9	81.7～111.7	0		適
パドル法 100rpm	pH 1.2	15	96.1～98.8	82.2～112.2	0		適

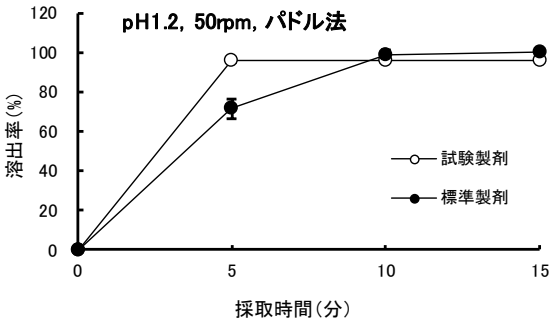
①②の結果より、すべての試験条件で判定基準を満たし、溶出挙動が同等と判定された。
従って、ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」と、標準製剤（ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」）は、生物学的に同等とみなされた。

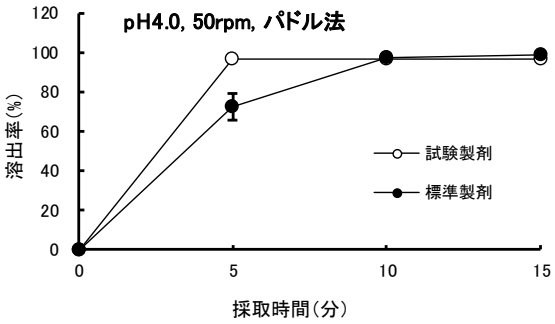
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」[50)]

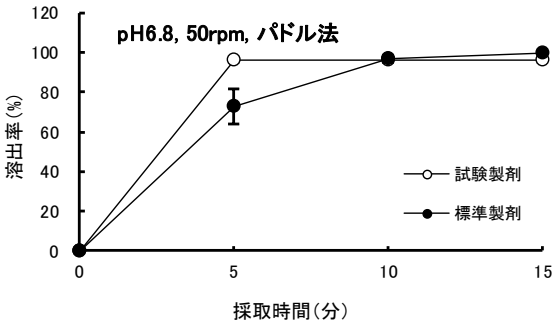
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）（以下、ガイドライン）に従い溶出試験を行った。

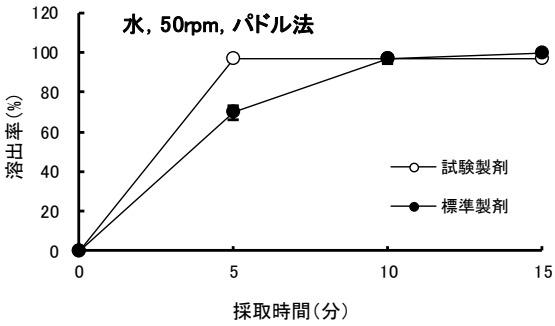
＜測定条件＞

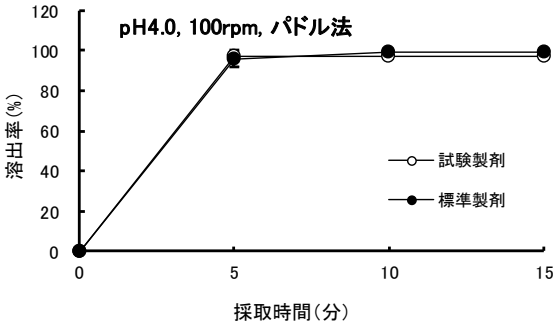
試 験 液	： pH1.2、pH4.0、pH6.8、水	検 体 数	： n=12
回 転 数	： 50rpm、100rpm	試 験 法	： パドル法
試験製剤	： ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「トーワ」	標準製剤	： タリオンOD 錠10 mg











平均溶出率(%)±S.D.

類似性の判定基準及び判定結果

試験条件		判定時間(分)	平均溶出率(%)		類似性の判定基準	判定
			試験製剤	標準製剤		
パドル法 50rpm	pH1.2	15	95.9	100.1	15 分以内に平均 85%以上溶出	適
	pH4.0	15	97.0	98.9		適
	pH6.8	15	96.2	99.6		適
	水	15	96.8	99.9		適
パドル法 100rpm	pH4.0	15	97.0	99.1		適

上記の結果より、すべての試験条件でガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合し、ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。
従って、ヒトにおける生物学的同等性試験を行い、ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」は標準製剤との生物学的同等性が確認された。

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

該当しない

(2) 包装

〈ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「トーワ」〉
100 錠［10 錠×10：PTP、乾燥剤入り］
〈ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」〉
100 錠［10 錠×10：PTP、乾燥剤入り］
500 錠［10 錠×50：PTP、乾燥剤入り］
500 錠［バラ、乾燥剤入り］
〈ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」〉
100 錠［10 錠×10：PTP、乾燥剤入り］
〈ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」〉
100 錠［10 錠×10：PTP、乾燥剤入り］
500 錠［10 錠×50：PTP、乾燥剤入り］
500 錠［バラ、乾燥剤入り］

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

包装形態	材質
PTP 包装	PTP　：ポリプロピレン、アルミ箔
	ピロー　：アルミニウム・ポリエチレンラミネート
バラ包装	瓶、蓋　：ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

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
○皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症）
〈小児〉
○アレルギー性鼻炎
○蕁麻疹
○皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

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

〈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。[12)]
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）

〈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。[17)]

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）

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

〈アレルギー性鼻炎〉

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。[13)]

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。[14)]

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）

〈蕁麻疹〉

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。[18)]

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。[19),20)]

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。[16]

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〕の眠気の副作用発現頻度は 5.5%（3/55 例）、プラセボ投与群は 1.9%（1/54 例）であった。[21]［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。[15),16),23),24]［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。[25]［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。[15]

〈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
			平均値	標準誤差	平均値	標準誤差	平均値	標準誤差	(無制約LSD法)
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。[21)]

〈皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症）〉

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。[22)]

〈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)及びケトチフェンフマル酸塩群(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/日のケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ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。[23)]

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

１．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

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、ロラタジン等のヒスタミン H_1 受容体拮抗剤

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。[26)]

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用

18.2.1 ベポタスチンベシル酸塩は H_1 受容体に対して選択的親和性を示し、5-HT_2、α_1、α_2、muscarinic 受容体等に対しては親和性を示さなかった（*in vitro*）。[27)]

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。[28),29)]

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。[28),29),30)]

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。[31)]

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。[32),33)]

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。[34)]

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（*in vitro*）。[35)]

(3) 作用発現時間・持続時間

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。[25)]

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

〈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 Cmax＝138.4±9.6ng/mL、平均値±標準誤差、n＝6)。[2)]

〈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。[3)]

	通年性アレルギー性鼻炎患者		アトピー性皮膚炎患者
	$C_{1\text{-}3hr}$※1	$C_{9\text{-}11hr}$※2	$C_{9\text{-}11hr}$※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）

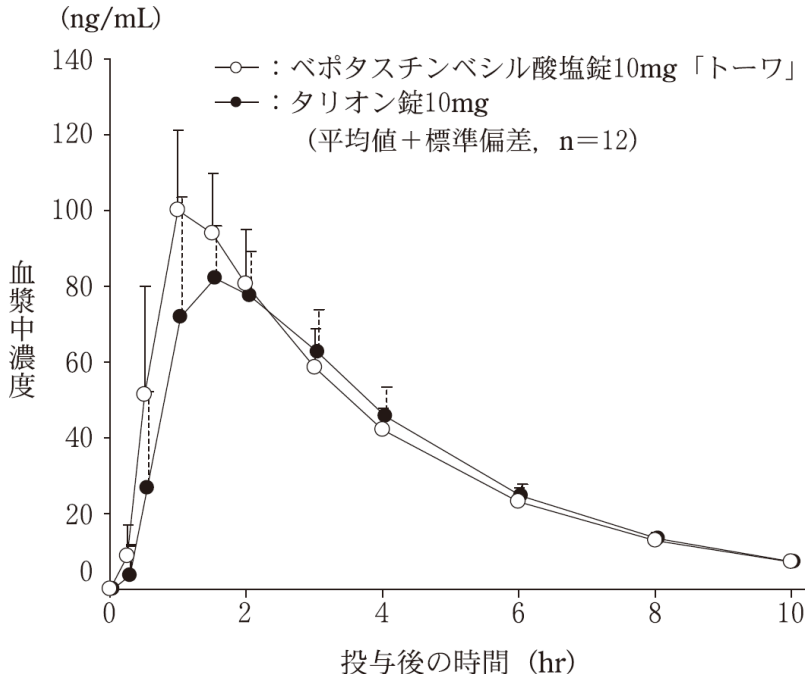
※1：投与 1 週時点、※2：投与 2 週時点

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。

16.1.3 生物学的同等性試験

〈ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」〉

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」とタリオン錠 10mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ベポタスチンベシル酸塩として 10mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中ベポタスチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。[4)]



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}10hr}$ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」	379.2±47.6	105.7±19.7	1.25±0.34	2.29±0.21
タリオン錠 10mg	360.4±47.3	90.5±15.3	1.42±0.36	2.29±0.25

（平均値±標準偏差，n＝12）

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。

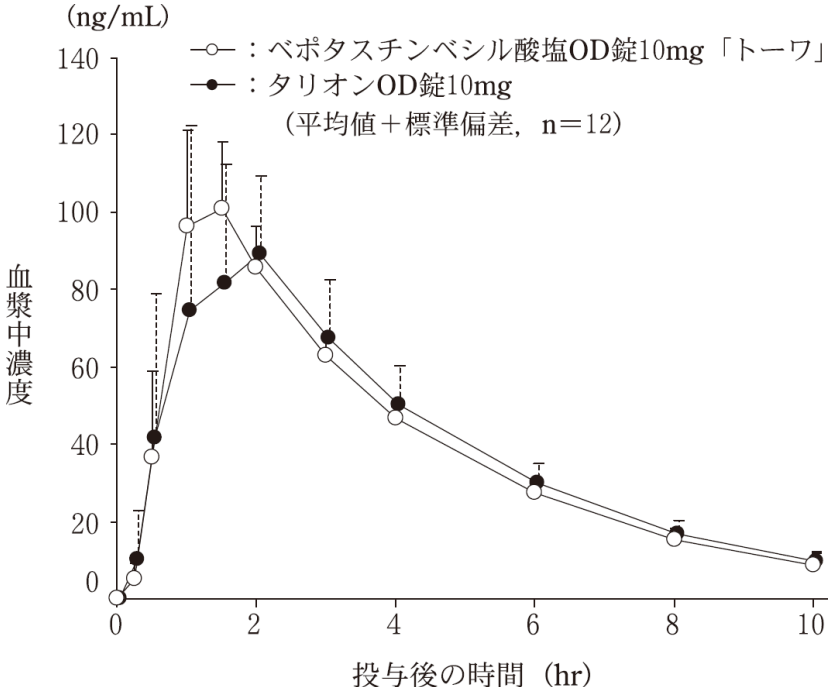
両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び 90%信頼区間

パラメータ	$AUC_{0\text{-}10hr}$	Cmax
平均値の差	log(1.0530)	log(1.1651)
平均値の差の 90%信頼区間	log(1.0226)～log(1.0844)	log(1.0969)～log(1.2375)

〈ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」〉

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」とタリオン OD 錠 10mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ベポタスチンベシル酸塩として 10mg）健康成人男子に絶食単回経口投与（水なしで服用及び水で服用）して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。[4)]

(1) 水なしで服用



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}10hr}$ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」	404.9±36.7	106.3±17.8	1.29±0.33	2.39±0.21
タリオン OD 錠 10mg	408.9±47.1	107.1±21.7	1.33±0.44	2.52±0.35

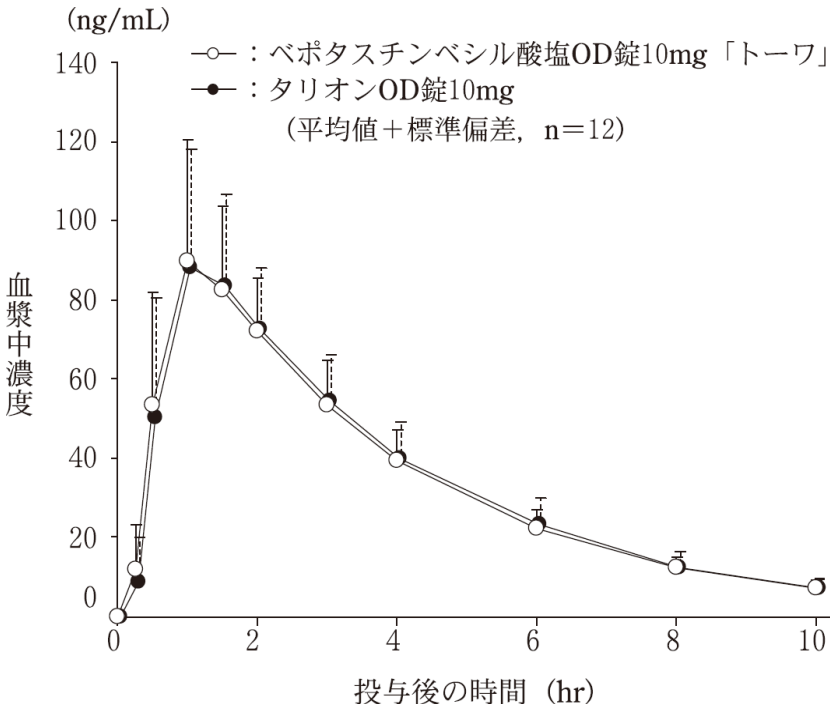
（平均値±標準偏差，n＝12）

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。

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び 90%信頼区間

パラメータ	$AUC_{0\text{-}10hr}$	Cmax
平均値の差	log(0.9926)	log(0.9995)
平均値の差の 90%信頼区間	log(0.9564)～log(1.0301)	log(0.9047)～log(1.1044)

(2) 水で服用



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}10hr}$ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」	352.2±61.3	94.9±22.3	1.13±0.38	2.38±0.30
タリオン OD 錠 10mg	354.7±62.5	95.7±16.2	1.29±0.58	2.31±0.28

（平均値±標準偏差，n＝12）

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。

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び 90%信頼区間

パラメータ	$AUC_{0\text{-}10hr}$	Cmax
平均値の差	log(0.9926)	log(0.9778)
平均値の差の 90%信頼区間	log(0.9566)～log(1.0300)	log(0.8726)～log(1.0958)

(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。[5)]

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「トーワ」[10]
kel：0.3045±0.0279hr^{-1}(健康成人男子、絶食単回経口投与)
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」[11]
1)水なしで服用
kel：0.2920±0.0265hr^{-1}(健康成人男子、絶食単回経口投与)
2)水で服用
kel：0.2958±0.0355hr^{-1}(健康成人男子、絶食単回経口投与)

(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

16.2.2 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。[5),6)]

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
該当資料なし
＜参考＞
「Ⅷ．6．(5) 妊婦」の項参照

(3) 乳汁への移行性
該当資料なし
＜参考＞
「Ⅷ．6．(6) 授乳婦」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

(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。[7)]

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。[5)]

(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。[2),5)]

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。

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

16.6.1 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。[8)]［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）	$AUC_{0-\infty}$ （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。[9]［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．用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

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。

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

9.1.1 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

(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[1)]。

(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 舌の上にの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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

18.6 一般薬理作用

18.6.1 ベポタスチンベシル酸塩の中枢神経系、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）。[36)]

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。[27),37),38)]

(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
該当しない

２．有効期間
3 年(錠 5mg、OD 錠)
4 年(錠 10mg)

３．包装状態での貯法
室温保存

４．取扱い上の注意
設定されていない

５．患者向け資材
患者向医薬品ガイド：有
くすりのしおり：有
その他の患者向け資材：無

６．同一成分・同効薬
同一成分：タリオン錠 5mg/10mg・OD 錠 5mg/10mg

７．国際誕生年月日
2000 年 7 月 3 日（日本）

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

販売名	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「トーワ」	2012 年 8 月 15 日	22400AMX01145000	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「トーワ」	2012 年 8 月 15 日	22400AMX01146000	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「トーワ」	2012 年 8 月 15 日	22400AMX01147000	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「トーワ」	2012 年 8 月 15 日	22400AMX01148000	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

効能又は効果追加、用法及び用量追加年月日：2019 年 11 月 6 日
内容：以下の下線部分を追加した。

	旧	新
効能又は効果	アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症）	＜成人＞ アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症） ＜小児＞ アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒
用法及び用量	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。	＜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。

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

販売名	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（9 桁） 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「トーワ」	4490022F1011	4490022F1100	125814101	622959000 （統一名） 622581401 （個別）
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」	4490022F2107	4490022F2107	125813401	622581301
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	4490022F3014	4490022F3065	125812701	622959100 （統一名） 622581201 （個別）
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」	4490022F4061	4490022F4061	125811001	622581101

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。

ＸＩ．文献

１．引用文献

電子添文の主要文献

1) 馬場駿吉：臨床医薬．2002；18(12)：1371-1387
2) 門阪利雄,他：臨床医薬．1997；13(5)：1155-1168
3) 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）
4) 高野和彦,他：診療と新薬．2018；55(3)：193-203
5) 横田秀雄,他：臨床医薬．1997；13(5)：1137-1153
6) 尿中排泄（タリオン錠：2000 年 7 月 3 日承認、申請資料概要へ.Ⅲ.(2).1)）
7) 血漿蛋白結合（タリオン錠：2000 年 7 月 3 日承認、申請資料概要へ.Ⅱ.(6).2)）
8) 川島一剛,他：臨床医薬．2003；19(6)：637-648
9) 熊谷雄治,他：臨床医薬．1997；13(5)：1169-1185
10) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 5mg）
11) 社内資料：生物学的同等性試験（OD 錠 5mg）
12) 馬場駿吉,他：臨床医薬．1997；13(5)：1217-1235
13) 馬場駿吉,他：臨床医薬．1997；13(5)：1259-1286
14) 馬場駿吉,他：臨床医薬．1997；13(5)：1307-1335
15) 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]（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、審査報告書）
16) 大久保公裕,他：アレルギー・免疫．2015；22(4)：578-589
17) 石橋康正,他：臨床医薬．1997；13(5)：1199-1215
18) 石橋康正,他：臨床医薬．1997；13(5)：1237-1257
19) 石橋康正,他：臨床医薬．1997；13(5)：1287-1306
20) 慢性蕁麻疹患者を対象とした二重盲検比較試験（タリオン錠：2000 年 7 月 3 日承認、申請資料概要ト.Ⅰ.7.(3)）
21) 川島 眞,他：臨床医薬．2002；18(4)：501-519
22) 石橋康正,他：臨床医薬．1997；13(5)：1383-1400
23) 川島 眞,他：臨床医薬．2015；31(3)：235-251
24) 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）
25) 石橋康正,他：臨床医薬．1997；13(5)：1187-1197
26) 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）
27) Kato M,et al.：Arzneimittelforschung．1997；47(10)：1116-1124
28) 谷藤直子,他：日本薬理学雑誌．1997；110：19-29
29) 本田浩子,他：薬理と治療．1997；25(4)：879-888
30) 坂本修身,他：薬理と治療．1997；25(4)：889-894
31) 村田隆司,他：アレルギー．1997；46(7)：576-584
32) Ueno M,et al.：Pharmacology．1998；57(4)：206-214
33) 好酸球機能抑制作用（タリオン錠：2000 年 7 月 3 日承認、申請資料概要ホ.Ⅰ.4）
34) Sakai A,et al.：Arzneimittelforschung．1997；47(8)：954-958
35) Kaminuma O,et al.：Biol Pharm Bull．1998；21(4)：411-413
36) 成田 寛,他：薬理と治療．1997；25(4)：907-924
37) Tanaka H,et al.：Res Commun Pharmacol Toxicol．1997；2(3)：163-174
38) 類薬から予想される薬理作用（タリオン錠：2000 年 7 月 3 日承認、申請資料概要ホ.Ⅱ.8）

その他の引用文献

39) 社内資料：加速試験（錠 5mg）
40) 社内資料：無包装における安定性試験（錠 5mg）
41) 社内資料：加速試験（錠 10mg）
42) 社内資料：長期保存試験（錠 10mg）

43) 社内資料：無包装における安定性試験（錠 10mg）
44) 社内資料：分割後の安定性試験（錠 10mg）
45) 社内資料：加速試験（OD 錠 5mg）
46) 社内資料：無包装における安定性試験（OD 錠 5mg）
47) 社内資料：加速試験（OD 錠 10mg）
48) 社内資料：無包装における安定性試験（OD 錠 10mg）
49) 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験（錠 10mg）
50) 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験（OD 錠 10mg）
51) 社内資料：粉砕後の安定性試験
52) 社内資料：崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性試験
53) 社内資料：自動分包機落下試験(湯山製作所製)（OD 錠 5mg/10mg）
54) 社内資料：自動分包機落下試験(タカゾノ製)（OD 錠 5mg/10mg）

２．その他の参考文献

該当資料なし

ⅩⅡ．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

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。

掲載根拠：「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する Q&A について（その 3）」（令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡）

(1) 粉砕 [51]

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」は，ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」と有効成分及び添加物の組成比が等しいことから，粉砕後の安定性につきましてはベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」の結果をご参照ください.

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg/10mg・OD 錠 10mg「トーワ」

■ 保存条件

粉砕した検体を以下の条件で保存した。

・室内散光

条件：成り行き温湿度、照度は 600lx 付近に調整
（累積照度は 3 箇月時点で 120 万 lx・hr 以上）

保存形態：シャーレ（ラップで覆う）

・防湿

条件：成り行き温湿度、照度は 600lx 付近に調整
（累積照度は 3 箇月時点で 120 万 lx・hr 以上）

保存形態：透明ねじ口ガラス瓶（密栓）

■ 結果

販売名	保存条件	試験項目	粉砕直後	1 箇月後	3 箇月後
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「トーワ」	室内散光	外観	白色の粉末	白色の粉末*1	白色の粉末*2
		含量(%)	97.7	98.5	100.1
		残存率(%)	100	100.8	102.5
	防湿	外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
		含量(%)	97.7	100.1	99.7
		残存率(%)	100	102.5	102.0
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」	室内散光	外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末*2
		含量(%)	100.1	99.8	100.1
		残存率(%)	100	99.7	100.0
	防湿	外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
		含量(%)	100.1	100.4	100.2
		残存率(%)	100	100.3	100.1
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」	室内散光	外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末*3
		含量(%)	99.4	99.5	100.1
		残存率(%)	100	100.1	100.6
	防湿	外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
		含量(%)	99.4	100.0	100.4
		残存率(%)	100	100.7	101.0

＊1：粉がシャーレにくっついていた
＊2：だまがあり、ざらついていた
＊3：湿気を含み、シャーレにはりついていた

ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg・OD 錠 10mg「トーワ」
保存期間：2013 年 7 月 3 日～2013 年 10 月 3 日
温度：22.5～25.9℃
湿度：29～66.5%RH

ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」
保存期間：2013 年 7 月 2 日～2013 年 10 月 2 日
温度：22.5～25.9℃
湿度：29～66.5%RH

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 [52)]

■　方法

①シリンジのプランジャーを抜き取り、シリンジ内に製剤 1 個を入れてプランジャーを戻し、お湯（55±1℃）あるいは室温水を 20mL 吸い取る。

②5 分間放置後、シリンジを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。崩壊不良の場合は再度 5 分間放置し、同様の操作を行う。

③崩壊しない場合は、錠剤に亀裂を入れたものについて①～②の作業を行う。

④チューブに取りつけ、流速約 2～3mL／秒で懸濁液を全て押し込んだ後、さらに水道水 20mL をシリンジで注入し洗いこみ後の残留物の有無を確認する。

■　試験器具・機器

チューブ：ニューエンテラルフィーディングチューブ（長さ：120cm）

シリンジ：Exacta-Med オーラルディスペンサー（透明）60mL サイズ

■　結果

販売名	試験項目	結果
ベポタスチンベシル酸塩錠 5mg「トーワ」	崩壊性	水（55℃）では崩壊不良であり、製剤破壊後、水（55℃）・10 分で崩壊した
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過する（全量を押し出せる）
	残存	ほとんどなし
	懸濁液 pH	pH 4.4
ベポタスチンベシル酸塩錠 10mg「トーワ」	崩壊性	水（55℃）では崩壊不良であり、製剤破壊後、水（55℃）・10 分でも錠剤形状は残っていた
	通過性*	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過する（全量を押し出せる）
	残存	シリンジにのみわずかに認められる（目視で残留物が確認できるが微量である）
	懸濁液 pH	pH 4.3

＊：錠剤形状は残っていたが、チューブは通過した。

販売名	試験項目	結果	
		水(55℃)	室温水
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	崩壊性	5 分で崩壊した	
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過する（全量を押し出せる）	
	残存	ほとんどなし	
	懸濁液 pH	pH 4.8	pH 4.4
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」	崩壊性	5 分で崩壊した	
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過する（全量を押し出せる）	
	残存	ほとんどなし	
	懸濁液 pH	pH 4.7	pH 4.2

２．その他の関連資料

東和薬品株式会社　医療関係者向けサイト

https://med.towayakuhin.co.jp/medical/

自動分包機落下試験

1）湯山製作所製　全自動錠剤分包機(YS-TR-260FDSⅡ)[53]

検　　体：ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg/10mg「トーワ」を Initial(開封直後) 及び加湿条件(25℃75%RH、7 日間)下で保存したもの

試験方法：各検体について、ローターカセットで一番負荷がかかると考えられる最上段(5 段目)及び負荷のかかりにくいと考えられる最下段(1 段目)に装着した。

判　　定：目視による割れ・欠けの有無

結　　果：

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	1 包あたり 1 錠包装		1 包あたり 5 錠包装	
	最上段	最下段	最上段	最下段
Initial	0／50 包	0／50 包	0／50 包	0／50 包
25℃75%RH・7 日間	0／50 包	0／50 包	0／50 包	0／50 包
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」	1 包あたり 1 錠包装		1 包あたり 5 錠包装	
	最上段	最下段	最上段	最下段
Initial	0／50 包	0／50 包	0／50 包	0／50 包
25℃75%RH・7 日間	0／50 包	0／50 包	0／50 包	0／50 包

（1 包中割れ・欠けが目視で認められた錠剤数／分包数）

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg/10mg「トーワ」は加湿の有無に関わらず、全ての条件で割れ・欠けを認める検体はなかった。ただし、ローターカセット内部に目視で確認できる程度の粉の付着が認められた。

2）タカゾノ製　全自動錠剤分包機(ESER 128HS-GP) (HP-J128HS)[54]

検　　体:ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg/10mg「トーワ」を Initial(開封直後)及び加湿条件(25℃75%RH、7 日間)下で保存したもの

試験方法：

①排出試験：錠剤カセットの動作確認用の自動排出装置を用い、各検体を 5000 錠連続で錠剤カセットから排出した。

②分包試験：各検体について、ローターカセットで一番負荷がかかると考えられる最上段(8 段目)及び負荷のかかりにくいと考えられる最下段(1 段目)に装着した。

判　　定：目視による割れ・欠けの有無

結　　果：

①排出試験：全ての検体で錠剤カセットから良好に排出され、錠剤の品質に影響を及ぼす割れ・欠けは確認されなかった。加湿による影響も特になかった。

②分包試験：

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	1 包あたり 1 錠包装		1 包あたり 5 錠包装	
	最上段	最下段	最上段	最下段
Initial	0／50 包	0／50 包	0／50 包	0／50 包
25℃75%RH・7 日間	0／50 包	0／50 包	0／50 包	0／50 包
ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 10mg「トーワ」	1 包あたり 1 錠包装		1 包あたり 5 錠包装	
	最上段	最下段	最上段	最下段
Initial	0／50 包	0／50 包	0／50 包	0／50 包
25℃75%RH・7 日間	0／50 包	0／50 包	0／50 包	0／50 包

（1 包中割れ・欠けが目視で認められた錠剤数／分包数）

ベポタスチンベシル酸塩 OD 錠 5mg/10mg「トーワ」は加湿の有無に関わらず、全ての条件で割れ・欠けを認める検体はなかった。

各自動分包機における留意事項：

口腔内崩壊錠についてはわずかではあるが粉立ちが避けられない。定期的なローターカセット内外の清掃が必要と考えられ、落下の衝撃を少なくするためにも、ローターカセット位置は下段を使用することが望ましい。

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

6版－1