

貯 法 : 気密容器、室温保存[※]

使用期限 : 外箱等に表示

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

	5mg「KN」	10mg「KN」
承認番号	23000AMX00430000	23000AMX00429000
薬価収載	2018年6月	2018年6月
*販売開始	2018年9月	2018年9月
**効能追加	2019年11月	2019年11月

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

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



ベポタスチンベシル酸塩口腔内崩壊錠

注)「取扱い上の注意」の項参照

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

品名	ベポタスチンベシル酸塩OD錠5mg「KN」	ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」
成分・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
添加物	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、スクラロース、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、香料、L-メントール、ステアリン酸マグネシウム	
性状	白色の素錠(口腔内崩壊錠)	白色の割線入りの素錠(口腔内崩壊錠)
大きさ	直径:約7.1mm 厚さ:約2.6mm 重量:約125mg	直径:約9.1mm 厚さ:約3.4mm 重量:約250mg
外形		
識別コード	ベポタ OD5 : ベポタスチンOD 5 KN	ベポタ OD10 : ベポタスチンOD 10 KN

**【効能・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、皮膚痒痒症)

<小児>

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚痒痒症)に伴う痒痒

**【用法・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。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

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

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

腎機能障害のある患者[本剤の血中濃度を上昇させることがある。また、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、低用量(例えば1回量5mg)から投与するなど慎重に投与し、異常が認められた場合は減量、休薬するなど適切な処置を行う。]

2. 重要な基本的注意

- (1) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械を操作する際には注意させること。
- (2) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量を図る場合には十分な管理下で徐々に行うこと。
- (3) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、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。
- (4) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

副作用が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻度不明
血液	白血球数増加、白血球数減少、好酸球増多
精神神経系	眠気、倦怠感、頭痛、頭重感、めまい
消化器	口渇、悪心、胃痛、胃部不快感、下痢、口内乾燥、舌炎、嘔吐、腹痛、便秘
過敏症	発疹、腫脹、蕁麻疹
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、γ-GTPの上昇、LDH、総ビリルビンの上昇
腎臓	尿潜血、尿蛋白、尿糖、尿ウロビリノーゲン、尿量減少、排尿困難、尿閉
その他	月経異常、浮腫、動悸、呼吸困難、しびれ、味覚異常

4. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、一般に高齢者では生理機能が低下していることが多いため高い血中濃度が持続するおそれがあるので注意すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には、治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立しておらず、また、動物実験で胎児への移行が認められている。]
- (2) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず本剤を投与する場合には授乳を避けさせること。[動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。]

6. 小児等への投与¹⁾

低出生体重児、新生児、乳児又は幼児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

7. 適用上の注意

(1)薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

(2)服用時：

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

【薬物動態】

<生物学的同等性試験>

1. ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5 mg「KN」

ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5 mg「KN」は、「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日付 薬食審査発0229第10号)に基づき、ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。²⁾

2. ベポタスチンベシル酸塩OD錠 10mg「KN」

ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」と標準製剤を、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10mg)健康成人男性に水あり及び水なしで絶食単回経口投与し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(図1、図2、表)。³⁾

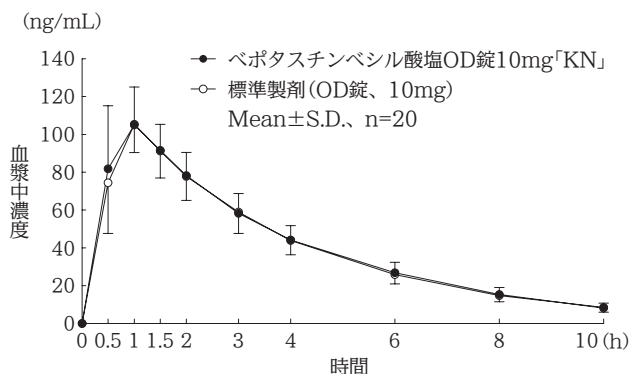


図1 ベポタスチンの血漿中濃度推移(水あり)

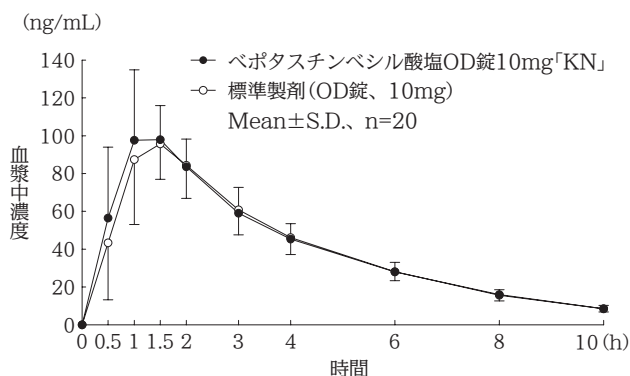


図2 ベポタスチンの血漿中濃度推移(水なし)

表 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ		
	AUC _{0-10h} (ng・h/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (h)	t _{1/2} (h)	
水あり	ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」	415.22±46.86	110.11±14.14	0.9±0.3	2.5±0.3
	標準製剤 (OD錠、10mg)	408.03±52.22	110.71±16.25	1.0±0.3	2.4±0.3
水なし	ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」	412.28±49.55	110.68±24.08	1.2±0.3	2.5±0.3
	標準製剤 (OD錠、10mg)	402.66±36.05	105.52±17.41	1.2±0.3	2.4±0.2

(Mean±S.D., n=20)

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

【薬効薬理】

抗アレルギー薬。ヒスタミンH₁受容体拮抗作用を主体とし、ケミカルメディエーター(ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF等)の産生・遊離抑制作用を現す。好酸球浸潤・増多抑制やインターロイキン-5の産生抑制も示唆されている。⁴⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ベポタスチンベシル酸塩(Bepotastine Besilate)

化学名：(S)-4-[4-[(4-Chlorophenyl)(pyridin-2-yl)methoxy]piperidin-1-yl]butanoic acid monobenzenesulfonate

分子式：C₂₁H₂₅ClN₂O₃・C₆H₆O₃S

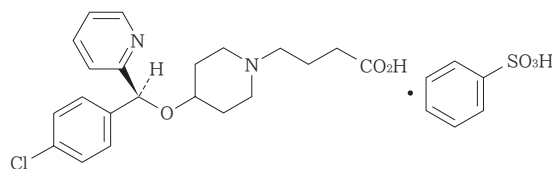
分子量：547.06

性状：白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。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。

1gを水100mLに溶かした液のpHは約3.8である。

融点：159～163℃

構造式：



【取扱い上の注意】

使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること。アルミビロー開封後は湿気を避けて保存すること。

<安定性試験>

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5 mg「KN」及びベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。⁵⁾

※【承認条件】

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

【包装】

ベポタスチンベシル酸塩OD錠 5 mg「KN」

PTP：100錠

ベポタスチンベシル酸塩OD錠10mg「KN」

PTP：100錠 140錠 500錠

バラ：100錠

【主要文献】

- **1) 馬場駿吉：臨床医薬、18(12)、1371-1387(2002)
- 2) 小林化工株式会社・社内資料(生物学的同等性試験)
- 3) 小林化工株式会社・社内資料(生物学的同等性試験)
- 4) 第十七改正日本薬局方解説書
- 5) 小林化工株式会社・社内資料(安定性試験)

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

小林化工株式会社 安全管理部

〒919-0603 福井県あわら市矢地5-15

☎ 0120-37-0690 TEL 0776-73-0911

FAX 0776-73-0821

製造販売元

 **小林化工株式会社**
福井県あわら市矢地5-15

(C. 11. 23)004