

# 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

## めまい・平衡障害治療剤

日本薬局方 ベタヒスチンメシル酸塩錠  
ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」  
ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」  
Betahistine Mesilate Tablets 「TSU」

剤形	6mg:白色フィルムコート錠 12mg:白色素錠	
製剤の規制区分	処方箋医薬品(注意－医師等の処方箋により使用すること)	
規格・含量	6mg:1錠中ベタヒスチンメシル酸塩 6mg を含有する 12mg:1錠中ベタヒスチンメシル酸塩 12mg を含有する	
一般名	和名:ベタヒスチンメシル酸塩 洋名:Betahistine Mesilate	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	6mg	製造販売承認年月日:2013年2月15日(販売名変更による) 薬価基準収載年月日:2013年6月21日(販売名変更による) 販売年月日:1978年4月1日
	12mg	製造販売承認年月日:2012年2月15日 薬価基準収載年月日:2012年6月22日 販売年月日:2012年7月20日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元:鶴原製薬株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	鶴原製薬株式会社 医薬情報部 TEL:072-761-1456(代表) FAX:072-760-5252 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/">http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/</a>	

本 IF は 2019 年 12 月改訂（第 13 版）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

<http://www.info.pmda.go.jp/>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・医療環境が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.info.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が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領 2013 として公表する運びとなった。

### 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IFの様式]

① 規格はA4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、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [IFの作成]

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

#### [IFの発行]

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

### 3. IFの利用にあたって

「IF記載要領 2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構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、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 月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	16
1. 開発の経緯	1	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	16
II. 名称に関する項目	2	5. 慎重投与内容とその理由	16
1. 販売名	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16
2. 一般名	2	7. 相互作用	16
3. 構造式又は示性式	2	8. 副作用	16
4. 分子式及び分子量	2	9. 高齢者への投与	17
5. 化学名(命名法)	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	17
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	11. 小児等への投与	17
7. CAS登録番号	2	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
III. 有効成分に関する項目	3	13. 過量投与	17
1. 物理化学的性質	3	14. 適用上の注意	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	15. その他の注意	18
3. 有効成分の確認試験法	3	16. その他	18
4. 有効成分の定量法	3	IX. 非臨床試験に関する項目	19
IV. 製剤に関する項目	4	1. 薬理試験	19
1. 剤形	4	2. 毒性試験	19
2. 製剤の組成	4	X. 管理的事項に関する項目	20
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	1. 規制区分	20
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	2. 有効期間又は使用期限	20
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	3. 貯法・保存条件	20
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5	4. 薬剤取扱い上の注意点	20
7. 溶出性	5	5. 承認条件等	20
8. 生物学的試験法	8	6. 包装	20
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8	7. 容器の材質	20
10. 製剤中の有効成分の定量法	8	8. 同一成分・同効薬	20
11. 力価	8	9. 国際誕生年月日	20
12. 混入する可能性のある夾雑物	8	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	21
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8	11. 薬価基準収載年月日	21
14. その他	8	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	21
V. 治療に関する項目	9	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
1. 効能又は効果	9	14. 再審査期間	21
2. 用法及び用量	9	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	21
3. 臨床成績	9	16. 各種コード	21
VI. 薬効薬理に関する項目	10	17. 診療報酬上の注意	21
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10	X I. 文献	22
2. 薬理作用	10	1. 引用文献	22
2. 薬理作用	10	2. その他の参考文献	22
VII. 薬物動態に関する項目	11	X II. 参考資料	22
1. 血中濃度の推移・測定法	11	1. 主な外国での発売状況	22
2. 薬物速度論的パラメータ	14	2. 海外における臨床支援情報	22
3. 吸収	14	X III. 備考	22
4. 分布	14	その他の関連資料	22
5. 代謝	15		
6. 排泄	15		
7. トランスポーターに関する情報	15		
8. 透析等による除去率	15		
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	16		
1. 警告内容とその理由	16		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」:

パパペリアン錠は、鶴原製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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、1977年2月17日に承認を取得、1978年4月1日に上市した。その後、医療過誤防止のため、2007年8月6日に製品名を「パパペリアン錠」から「パパペリアン錠 6mg」に変更の承認を得て、2008年6月20日より販売の運びとなった。その後、2013年2月に「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)に基づき、『ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」』に販売名変更の承認を得て、2013年6月より販売となった。

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」:

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」は、「後発医薬品の必要な規格を揃えること等について」(平成18年3月10日医政発第0310001号)により、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2月15日に承認を取得、2012年6月に発売した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

ベタヒスチンメシル酸塩は、ヒスタミン類似の血管拡張作用を有し、内耳の微小循環を改善してメニエール病をはじめとする内示循環障害にもとづくめまい、めまい感を消退させる。

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1)和名：

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」

#### (2)洋名：

Betahistine Mesilate Tablets 6mg 「TSU」

Betahistine Mesilate Tablets12mg 「TSU」

#### (3)名称の由来

一般名+剤形+規格(含量)+「ツルハラ」

〔「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〕

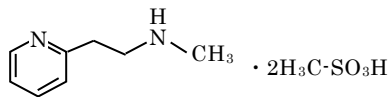
### 2. 一般名

(1)和名(命名法)：ベタヒスチンメシル酸塩

(2)洋名(命名法)：Betahistine Mesilate

(3)ステム：不明

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式： $C_8H_{12}N_2 \cdot 2CH_4O_3S$

分子量：328.41

### 5. 化学名(命名法)

*N*-Methyl-2-pyridin-2-ylethylamine dimethanesulfonate

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

メシル酸ベタヒスチン

### 7. CAS登録番号

5638-76-6 ベタヒスチン

### 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：水に極めて溶けやすく、酢酸(100)に溶けやすく、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：110～114℃（乾燥後）
- (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：本品は希塩酸に溶ける。本品は吸湿性である。

#### 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

日本薬局方の医薬品各条の「ベタヒスチンメシル酸塩」確認試験法による。

#### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方の医薬品各条の「ベタヒスチンメシル酸塩」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：

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」：白色のフィルムコート錠

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」：片面割線を有する白色の素錠

			直径：約 7.1mm 厚さ：約 4.1mm 質量：約 145mg
			直径：約 8.0mm 厚さ：約 3.0mm 質量：約 200mg

(2) 製剤の物性：該当資料なし

(3) 識別コード：

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」：TSU562

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」：TSU571

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等：該当資料なし

### 2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量：

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」：1 錠中ベタヒスチンメシル酸塩 6mg

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」：1 錠中ベタヒスチンメシル酸塩 12mg

(2) 添加物：

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」：乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、低置換度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、タルク、酸化チタン、カルナウバロウ

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」：タルク、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸カルシウム

(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

該当資料なし



#### 4. 製剤の各種条件下における安定性

- ・ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」

加速試験 P T P 包装 40℃75%RH

	性状	確認試験	崩壊試験	定量
製造時	白色のフィルムコート錠	(1)適(2)適	適	適
6 箇月	同上	同上	同上	同上

苛酷試験 P T P 包装 光照射(2000ルクス)

	性状	確認試験	崩壊試験	定量
製造時	白色のフィルムコート錠	(1)適(2)適	適	適
1 箇月	同上	同上	同上	同上

長期保存試験 P T P 包装 室温

	性状	確認試験	崩壊試験	定量
製造時	白色のフィルムコート錠	(1)適(2)適	適	適
3 年	同上	同上	同上	同上

- ・ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」

長期保存試験 P T P 包装 室温

	性状	確認試験	溶出試験	定量
製造時	割線を有する白色の素錠	適	適	適
3 年	同上	同上	同上	同上

#### 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

#### 6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当資料なし

#### 7. 溶出性

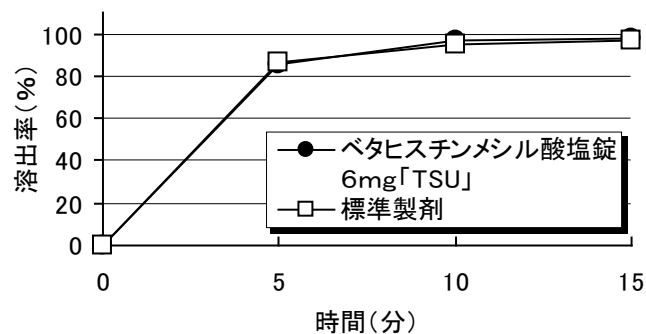
ベタヒスチンメシル酸塩錠 6 m g 「TSU」の溶出は、日本薬局方医薬品各条「ベタヒスチンメシル酸塩錠」の判定基準に適合した。

試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）

回転数：毎分50回転

試験液：水

溶出規格：15分 85%以上

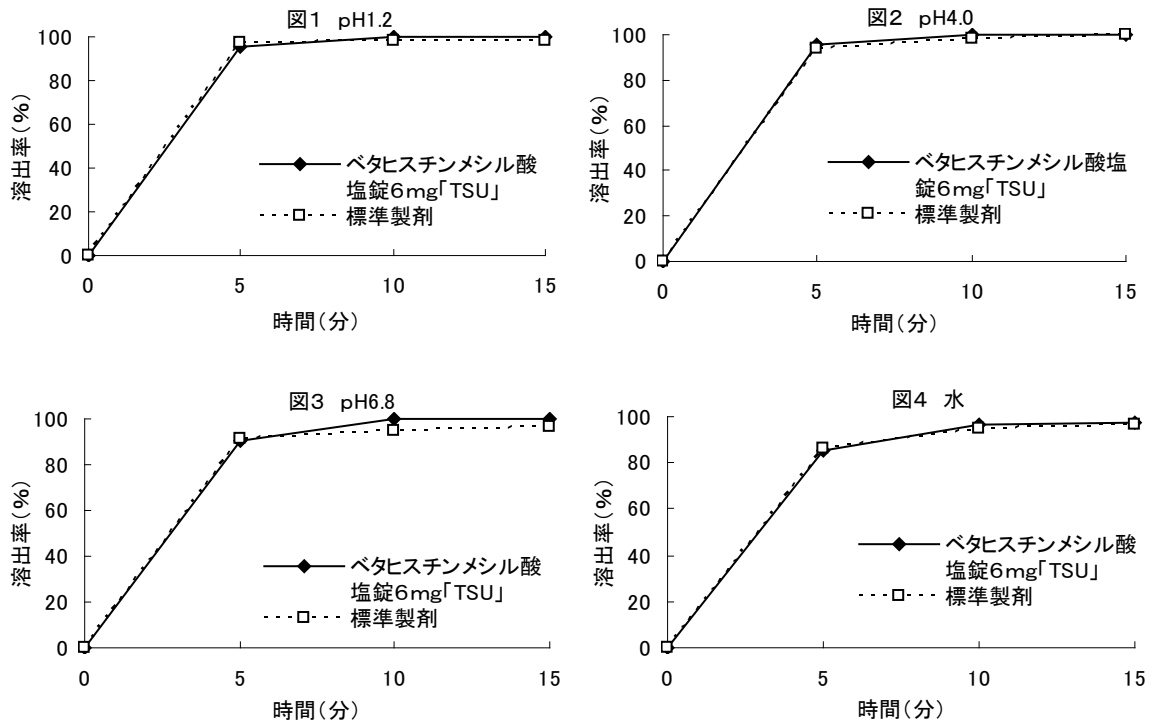


ベタヒスチンメシル酸塩錠 6 m g 「TSU」につき、標準製剤を対照として、下記に示す4種試験液を用いて溶出試験を実施した。

試験結果

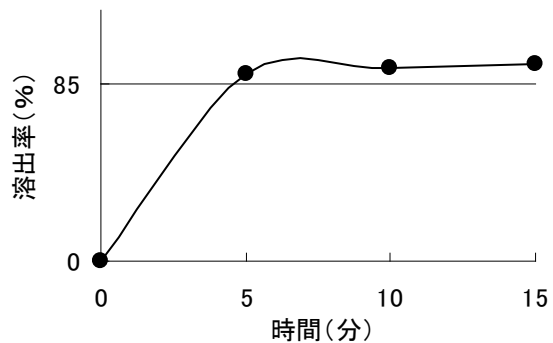
標準製剤を対照としたベタヒスチンメシル酸塩錠 6 m g 「TSU」の溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6 m g 「TSU」の溶出パターンは、標準製剤と同等であった。



ベタヒスチンメシル酸塩錠 12m g 「TSU」の溶出は、日本薬局方医薬品各条「ベタヒスチンメシル酸塩錠」の溶出規格に適合した。

試験方法：溶出試験法第2法  
 回転数：毎分50回転  
 試験液：水  
 溶出規格：15分 85%以上

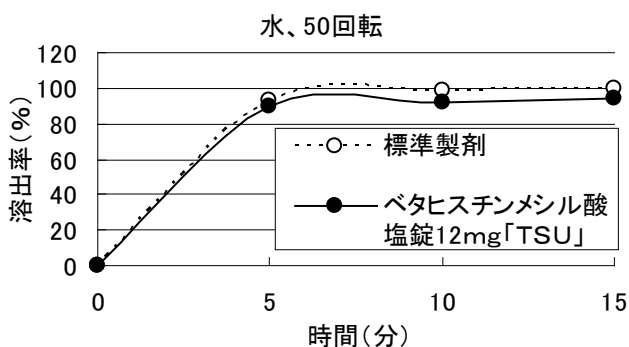
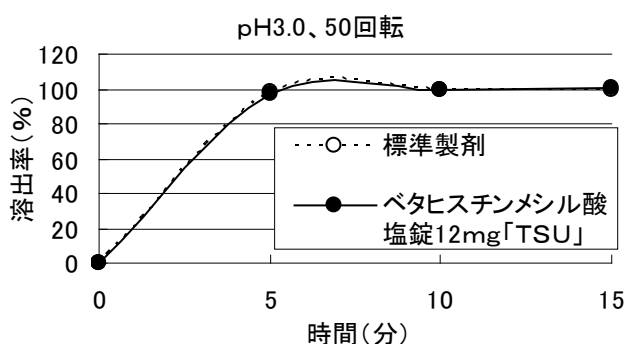
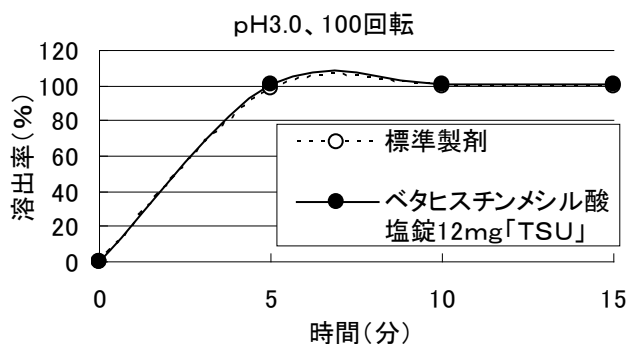
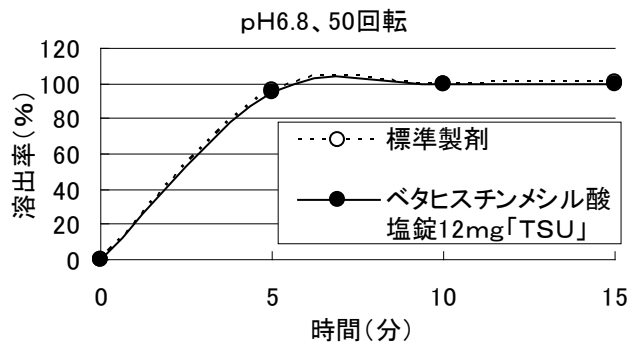
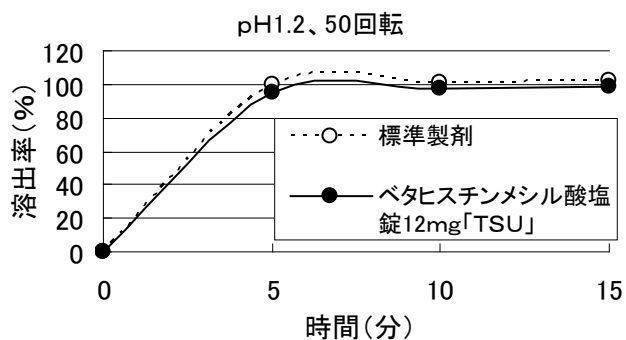


ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」につき、標準製剤を対照として、下記に示す試験液を用いて溶出試験を実施した。

試験結果

標準製剤を対照としたベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」の溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」の溶出パターンは、標準製剤と同等であった。



## 8. 生物学的試験法

該当資料なし

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方の医薬品各条の「ベタヒスチンメシル酸塩錠」確認試験法による。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方の医薬品各条の「ベタヒスチンメシル酸塩錠」定量法による。

## 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

該当資料なし

## 14. その他

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

下記疾患に伴うめまい、めまい感  
メニエール病、メニエール症候群、眩暈症

### 2. 用法及び用量

成人1回1～2錠(ベタヒスチンメシル酸塩として6～12mg)を1日3回食後経口投与する。

### 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. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

### 2. 薬理作用

#### (1)作用部位・作用機序

モルモットを用いた実験で蝸牛放射状細動脈の血流量を増加させる作用が認められ、特に病的状態下での効果が顕著である<sup>1)</sup>。

#### (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

(「臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」と標準製剤との血中濃度比較による検討

### 1. 緒言

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」と標準製剤との生物学的同等性を検討するため、両製剤投与後の血漿中 2-ピリジル酢酸 (ベタヒスチンメシル酸塩の主代謝物) 濃度推移を比較した。

### 2. 実験方法

#### (1) 対象

あらかじめ健康診断を実施し、異常の認められなかった健康成人男子 17 名

#### (2) 投与量

製剤試験により同等と認められた両製剤 1 錠 (ベタヒスチンメシル酸塩として 12mg) ずつを経口投与した。

#### (3) 投与方法

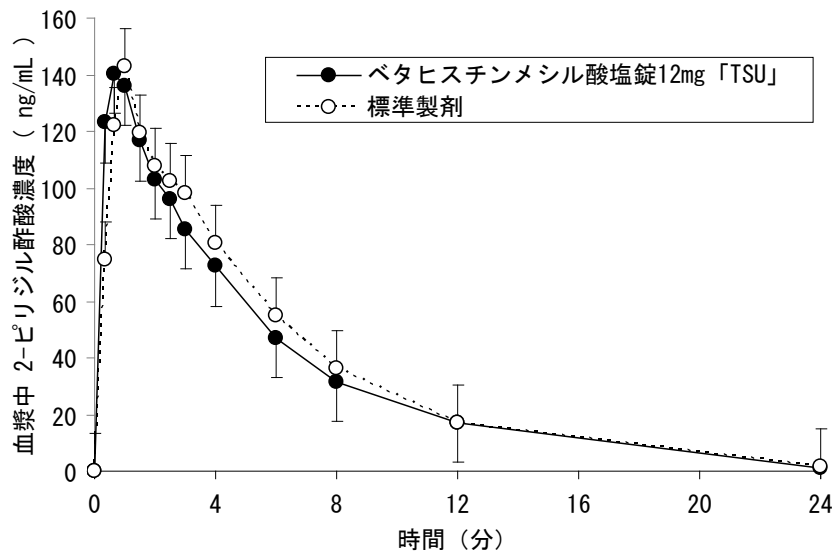
健康成人男子志願者で事前に文書による同意を得られた 17 名を 2 群に分け、医師の問診の後、1 群にはベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」、他群には標準製剤を絶食時経口投与した。1 週間の間隔でクロスオーバー法により投与した。

#### (4) 採血時間

投与前、20 分、40 分、1 時間、1.5 時間、2 時間、2.5 時間、3 時間、4 時間、6 時間、8 時間、12 時間、24 時間

### 3. 結果

得られた薬物動態パラメータ (AUC、C<sub>max</sub>) について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。以上の結果よりベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」及び標準製剤は生物学的同等性を有する製剤であると推定される。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC 0-24 (ng · hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t1/2 (hr)
ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」	805.1 ± 67.1	169.9 ± 15.0	0.80 ± 0.13	4.65 ± 0.66
標準製剤 (錠剤、12mg)	849.8 ± 54.8	162.0 ± 11.5	1.30 ± 0.20	4.14 ± 0.30

(mean ± S.E. n=17)

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。



## 《参考》

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6 m g 「TSU」と標準製剤との生物学的同等性を検討するため、家兎を用いたクロスオーバー法による両製剤投与後のベタヒスチンメシル酸塩代謝物である2-ピリジル酢酸の血清中濃度推移及び尿中排泄量を比較した。

### 1. 実験方法

#### (1) 使用薬剤

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6 m g 「TSU」

標準製剤

#### (2) 対象

家兎 10 羽

#### (3) 投与量

製剤試験により同等と認められた両製剤 20 錠 (ベタヒスチンメシル酸塩として 120mg) ずつを経口投与した。

#### (4) 投与方法

家兎 10 羽を 2 群に分け、1 群にはベタヒスチンメシル酸塩錠 6 m g 「TSU」、他群には標準製剤を強制経口投与した。クロスオーバー法を用い、休薬期間を 1 週間と設定した。

#### (5) 採血時間

投与前、1 時間、2 時間、3 時間、6 時間

### 2. 結果

血清中 2-ピリジル酢酸濃度は、投与後 1 時間目に両製剤とも最高血清中濃度に達し、その後急速に減少し、投与後 6 時間目ではほとんどなくなった。

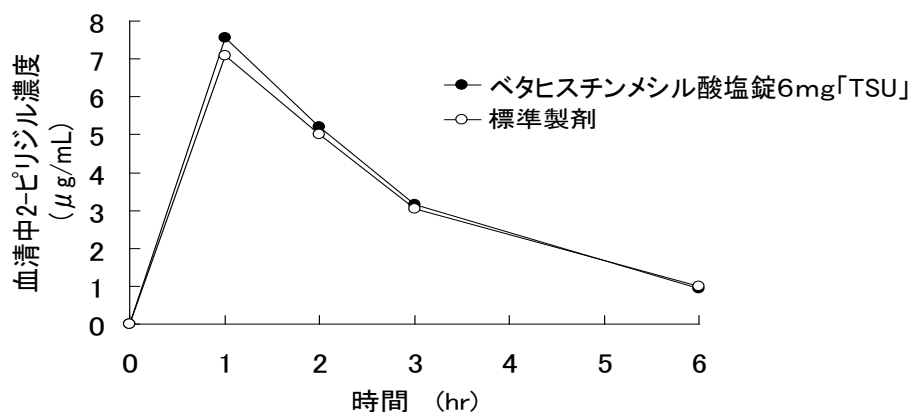
この結果について、くり返しのある 2 元配置で分散分析したところ、投与順序 (A 因子) および投与製剤 (B 因子) の寄与は小さく問題はなかった。

また、各時間における 2-ピリジル酢酸の平均値について有意差検定をした結果、どの時間でも有意差は認められなかった。

次に尿中排泄量については 2~6 時間で大部分排泄されており、血清中濃度と同様の統計学的検討を加えた結果、どの時間でも有意差は認められなかった。

以上の実験及び統計学的検討の結果から、ベタヒスチンメシル酸塩錠 6 m g 「TSU」および標準製剤は同等の製剤であると認められる。

血清中2-ピリジル濃度推移



(4)中毒域

該当資料なし

(5)食事・併用薬の影響

(「Ⅷ. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目 7.相互作用」の項を参照のこと)

(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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(3)乳汁への移行性

該当資料なし

(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

該当資料なし

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

該当しない

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 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) 消化性潰瘍の既往歴のある患者及び活動性の消化性潰瘍のある患者〔本剤はヒスタミン類似作用を有するため、H<sub>2</sub>受容体を介して胃酸分泌亢進を引き起こすおそれがある。〕
- 2) 気管支喘息の患者〔本剤はヒスタミン類似作用を有するため、H<sub>1</sub>受容体を介して気道の収縮を引き起こすおそれがある。〕
- 3) 褐色細胞腫のある患者〔本剤はヒスタミン類似作用を有するため、アドレナリンの過剰分泌により血圧上昇を引き起こすおそれがある。〕

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

### 7. 相互作用

該当しない

### 8. 副作用

#### (1)副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

#### (2)重大な副作用と初期症状

該当なし

### (3) その他の副作用

	頻 度 不 明
消化器	悪心・嘔吐
過敏症*	発疹

\*：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。

### (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

該当資料なし

## 9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

## 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断された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いない。〕

## 11. 小児等への投与

小児に対する安全性は確立していない。(使用経験が少ない。)

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

## 13. 過量投与

該当資料なし

## 14. 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**

該当資料なし

**16. その他**

該当資料なし

## 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)

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（注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

本剤は吸湿性のため湿気を避けて室温保存

### 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

（「規制区分」及び「貯法・保存条件」の項を参照のこと）

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 14.適用上の注意」の項を参照のこと）

(3) 調剤時の留意点について

### 5. 承認条件等

なし

### 6. 包装

ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」：(PTP) 100錠、1000錠 （バラ）1200錠

ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」：(PTP) 100錠

### 7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル アルミ箔

バラ：セロニウム袋 ブリキ缶

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：メリスロン錠 6mg・12mg（エーザイ株式会社）

### 9. 国際誕生年月日

不明



10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」	2013年2月15日	22500AMX00736000
ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」	2012年2月15日	22400AMX00176000

11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日
ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」	2013年6月21日
ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」	2012年6月22日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

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

2001年12月25日(品質再評価)

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 (9桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
ベタヒスチンメシル酸塩錠 6mg 「TSU」	102345901	1339005F1016	622164501
ベタヒスチンメシル酸塩錠 12mg 「TSU」	121645501	1339005F2012	622164501

17. 診療報酬上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

## X I. 文献

### 1. 引用文献

1) 斉藤等 他：耳鼻臨床, 60, 1112 (1967)

### 2. その他の参考文献

第 17 改正 日本薬局方

## X II. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当しない

## X III. 備考

### その他の関連資料

なし



製造販売元

**鶴原製薬株式会社**

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号

文献請求先：鶴原製薬（株）医薬情報部