

めまい・平衡障害治療剤

処方箋医薬品^注

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「トーフ」

ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「トーフ」

BETAHISTINE MESILATE TABLETS 6mg "TOWA"/ TABLETS 12mg "TOWA"

貯 法：室温保存

有効期間：3年

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

	錠6mg	錠12mg
承認番号	22800AMX00492	22800AMX00493
販売開始	2017年6月	

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ベタヒスチンメシル酸塩錠6mg「トーフ」	ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「トーフ」
1錠中の有効成分	日局 ベタヒスチンメシル酸塩 ……………6mg	日局 ベタヒスチンメシル酸塩 ……………12mg
添加剤	D-マンニトール、結晶セルロース、タルク、ヒドロキシプロピルセルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸カルシウム	

3.2 製剤の性状

販売名	ベタヒスチンメシル酸塩錠6mg「トーフ」	ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「トーフ」	
性状・剤形	白色の割線入りの素錠		
識別コード	本体	Tw320	Tw340
	包装		
外形	表		
	裏		
	側面		
直径(mm)	8.0	8.0	
厚さ(mm)	2.8	3.0	
質量(mg)	180	200	

4. 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

6. 用法及び用量

(ベタヒスチンメシル酸塩錠6mg「トーフ」)

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

ただし、年齢、症状により適宜増減する。

(ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「トーフ」)

通常、成人は1回1錠を1日3回食後経口投与する。（なおベタヒスチンメシル酸塩としての1回の用量は6～12mgである。）

ただし、年齢、症状により適宜増減する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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、H₂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。

9.1.2 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、H₁受容体を介して気道の収縮を引き起こすおそれがある。

9.1.3 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。

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た場合にのみ投与すること。

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。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

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。

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満
消化器	悪心・嘔吐
過敏症	発疹

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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に刺入し、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。

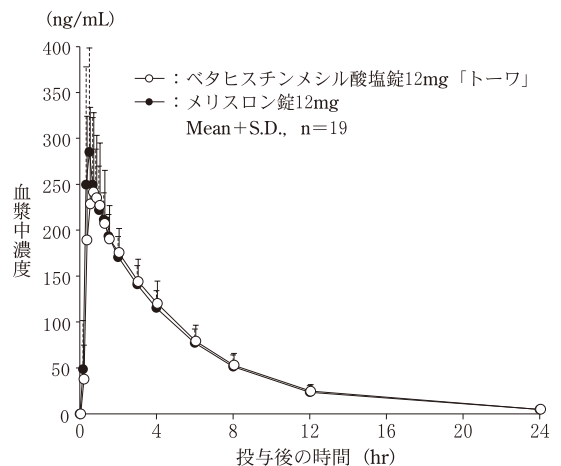
16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

(ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「トーフ」)

ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「トーフ」とメリスロン錠12mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ベタヒスチンメシル酸塩として12mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して主代謝物である2-ピリジル酢酸の血漿中濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾



	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)	T _{1/2} (hr)
ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「トーワ」	1325±229	299±74	0.83±0.81	4.50±0.66
メリスロン錠12mg	1315±198	334±64	0.58±0.27	4.42±0.52

(Mean±S. D., n=19)

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。

16.8 その他

〈ベタヒスチンメシル酸塩錠6mg「トーワ」〉

ベタヒスチンメシル酸塩錠6mg「トーワ」は、ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「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。²⁾

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床成績

総計298例について実施された二重盲検試験を含む臨床試験で、ベタヒスチンメシル酸塩はメニエール病、メニエール症候群、眩暈症等に伴うめまい、めまい感に対して有効性が認められている。^{3)~7)}

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

本剤の有効成分であるベタヒスチンの作用機序は不明である。

18.2 内耳循環障害の改善作用

モルモットの実験的内耳微小循環障害に、ベタヒスチンメシル酸塩を腹腔内投与し、30分後に、対照群に比較して148%の血流増加が認められている。また、この現象は、病的状態において特異的にみられる。⁸⁾

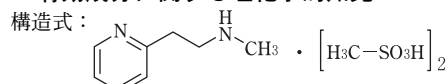
18.3 蝸牛管血流量の増加作用

内リンパ水腫モルモットにベタヒスチンメシル酸塩を経口投与すると、蝸牛管血流量は5.5mL/min/100gから8.1mL/min/100gとなり、有意に増加した。これは、蝸牛放射状動脈の血管平滑筋弛緩作用により、血流量増加を生じたものと推察される。⁹⁾

18.4 脳内血流量の改善作用

アカゲザルの実験によるとベタヒスチンメシル酸塩の静脈内投与により、大脳組織及び小脳組織の血流をそれぞれ70.4から81.4mL/100g/min、73.2から84.0mL/100g/min.に増加させることが認められている。¹⁰⁾

19. 有効成分に関する理化学的知見



一般名：ベタヒスチンメシル酸塩 (Betahistine Mesilate)

化学名：*N*-Methyl-2-pyridin-2-ylethylamine dimethanesulfonate

分子式： $C_8H_{12}N_2 \cdot 2CH_4O_3S$

分子量：328.41

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。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。希塩酸に溶ける。吸湿性である。

融点：110~114℃ (乾燥後)

22. 包装

〈ベタヒスチンメシル酸塩錠6mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP、乾燥剤入り]

1000錠 [10錠×100：PTP、乾燥剤入り]

1000錠 [バラ、乾燥剤入り]

〈ベタヒスチンメシル酸塩錠12mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP、乾燥剤入り]

1000錠 [10錠×100：PTP、乾燥剤入り]

500錠 [バラ、乾燥剤入り]

23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験 (錠12mg)
- 社内資料：生物学的同等性試験 (錠6mg)
- 渡辺 勲ら：耳鼻咽喉科, 1967; 39(11)：1237-1250
- 岡本 健ら：医療, 1968; 22(5)：650-665
- 石川 馨ら：新薬と臨床, 1983; 32(4)：631-635
- 佐藤護人ら：薬物療法, 1980; 13(4-5)：257-260
- 野末道彦ら：薬理と治療, 1978; 6(1)：139-151
- 斉藤 等ら：耳鼻咽喉科臨床, 1967; 60(12)：1112-1115
- 北野 仁：耳鼻咽喉科臨床, 1985; 78(8)：1615-1626
- Tomita, M. et al.：Stroke, 1978; 9(4)：382-387

24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター
〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号
☎0120-108-932 FAX 06-7177-7379

26. 製造販売業者等

26.1 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