

# 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 $\beta_1$ 遮断剤

### ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」

### ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」

### Betaxolol Hydrochloride Tab.

剤形	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	錠 5mg : 1錠中ベタキソロール塩酸塩 5mg 含有 錠 10mg : 1錠中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 洋名：Betaxolol Hydrochloride
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	承認年月日 : 2013年7月22日 薬価基準収載 : 2023年8月30日 発売年月日 : 2002年7月5日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	販 売 : 武田薬品工業株式会社 発 売 元 : 日医工株式会社 製造販売元 : 日医工岐阜工場株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL : 0120-517-215 FAX : 076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>

本IFは2023年8月改訂（第17版，承継に伴う改訂）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は，医薬品医療機器総合機構ホームページ  
<https://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

## 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式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、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月改訂)

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	1	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	12
1. 開発の経緯 .....	1	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ..	12
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1	2. 薬理作用 .....	12
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	2	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	13
1. 販売名 .....	2	1. 血中濃度の推移・測定法 .....	13
2. 一般名 .....	2	2. 薬物速度論的パラメータ .....	15
3. 構造式又は示性式 .....	2	3. 吸収 .....	15
4. 分子式及び分子量 .....	2	4. 分布 .....	15
5. 化学名（命名法） .....	2	5. 代謝 .....	16
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 .....	2	6. 排泄 .....	16
7. CAS 登録番号 .....	2	7. トランスポーターに関する情報 .....	16
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	3	8. 透析等による除去率 .....	16
1. 物理化学的性質 .....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	3	1. 警告内容とその理由 .....	17
3. 有効成分の確認試験法 .....	3	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） ..	17
4. 有効成分の定量法 .....	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 .....	17
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	4	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 .....	17
1. 剤形 .....	4	5. 慎重投与内容とその理由 .....	17
2. 製剤の組成 .....	4	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 ..	18
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 .....	4	7. 相互作用 .....	18
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	5	8. 副作用 .....	19
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	8	9. 高齢者への投与 .....	20
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	8	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 .....	20
7. 溶出性 .....	8	11. 小児等への投与 .....	20
8. 生物学的試験法 .....	10	12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	20
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	10	13. 過量投与 .....	20
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	10	14. 適用上の注意 .....	21
11. 力価 .....	10	15. その他の注意 .....	21
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	10	16. その他 .....	21
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....	10	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	22
14. その他 .....	10	1. 薬理試験 .....	22
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	11	2. 毒性試験 .....	22
1. 効能又は効果 .....	11	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	23
2. 用法及び用量 .....	11	1. 規制区分 .....	23
3. 臨床成績 .....	11		

2.	有効期間又は使用期限	23
3.	貯法・保存条件	23
4.	薬剤取扱い上の注意点	23
5.	承認条件等	23
6.	包装	23
7.	容器の材質	23
8.	同一成分・同効薬	23
9.	国際誕生年月日	23
10.	製造販売承認年月日及び承認番号	23
11.	薬価基準収載年月日	23
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	24
13.	再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	24
14.	再審査期間	24
15.	投薬期間制限医薬品に関する情報	24
16.	各種コード	24
17.	保険給付上の注意	24
<b>X I.</b>	<b>文献</b>	<b>25</b>
1.	引用文献	25
2.	その他の参考文献	25
<b>X II.</b>	<b>参考資料</b>	<b>26</b>
1.	主な外国での発売状況	26
2.	海外における臨床支援情報	27
<b>X III.</b>	<b>備考</b>	<b>28</b>
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	28
2.	その他の関連資料	31

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、ベタキソロール塩酸塩を有効成分とするアドレナリン $\beta_1$ 受容体の選択的遮断薬である。

「アロング錠 5mg」及び「アロング錠 10mg」は、武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）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、2002年2月25日に承認を取得、2002年7月5日に販売を開始した。（医薬発第481号（平成11年4月8日）に基づき承認申請）

2005年10月13日再評価（品質再評価）の結果、薬事法第14条第2項各号（承認拒否自由）のいずれにも該当しないとの再評価結果を得た。

「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成12年9月19日 医薬発第935号）に基づき、販売名を「アロング錠 5mg」及び「アロング錠 10mg」から「ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「テバ」」及び「ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「テバ」」へ変更して、2013年7月22日に承認を取得、2013年12月13日に薬価基準収載された。

2023年8月1日、「ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「テバ」」及び「ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「テバ」」は、武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「テバ」から「NIG」に変更した。

2023年8月30日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、ベタキソロール塩酸塩を有効成分とするアドレナリン $\beta_1$ 受容体の選択的遮断薬である。
- (2) 重大な副作用(頻度不明)として、完全房室ブロック、心胸比増大、心不全が報告されている。

## 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 「NIG」

ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」

#### (2) 洋名

Betaxolol Hydrochloride Tab.

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

ベタキソロール塩酸塩 (JAN)

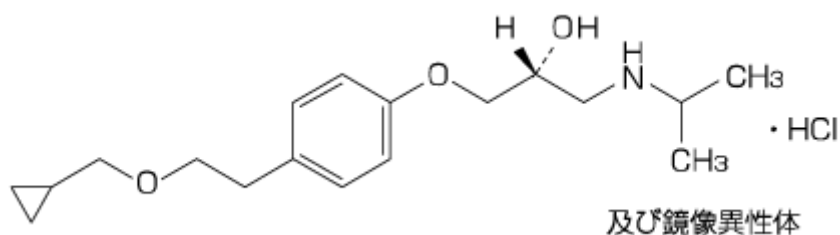
#### (2) 洋名 (命名法)

Betaxolol Hydrochloride (JAN)

#### (3) ステム

アリールオキシアミノアルコール構造を持つアドレナリン  $\beta$  受容体拮抗薬：-olol

### 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：塩酸ベタキソロール

### 7. CAS 登録番号

3659-19-8

### 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

水に極めて溶けやすく、メタノール、エタノール (99.5) 又は酢酸 (100) に溶けやすい。

各種 pH における溶解度<sup>2)</sup>

溶液	溶解度 (37℃)
pH1.2	1g/mL 以上
pH4.0	1g/mL 以上
pH6.8	1g/mL 以上
水	1g/mL 以上

##### (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<sup>2)</sup>

pKa: 9.5 (第二アミノ基, 滴定法)

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

水溶液 (1→100) は旋光性を示さない。

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

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性<sup>2)</sup>

液性 (pH)	pH1.0 において, 40℃, 20 日間で約 2% 分解する。 pH3.0~pH9.0 において, 40℃, 20 日間は安定である (1% 溶液)。
光	固体は, 2000Lx, 30 日間は安定である。 1% 水溶液は, 2000Lx, 30 日間で約 0.4% 分解する。

#### 3. 有効成分の確認試験法

##### (1) 紫外可視吸光度測定法

本品のエタノール溶液につき吸収スペクトルを測定し, 本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき, 両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

##### (2) 赤外吸収スペクトル測定法

塩化カリウム錠剤法により試験を行い, 本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき, 両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

##### (3) 塩化物の定性反応

本品の水溶液は塩化物の定性反応 (2) を呈する。

#### 4. 有効成分の定量法

##### 電位差滴定法



本品を酢酸に溶かし, 無水酢酸を加え, 0.1mol/L 過塩素酸で滴定



#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別, 外観及び性状

販売名	ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」	ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」
色調・剤形	白色の片面 1/2 割線入り素錠	
外形		
直径 (mm)	6.5	7.0
厚さ (mm)	2.4	2.6
質量 (mg)	100	125
識別コード (PTP)	tBX 5mg	tBX 10mg

###### (2) 製剤の物性

(「IV. 4. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

###### (3) 識別コード

(「IV. 1. (1) 剤形の区別, 外観及び性状」の項参照)

###### (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

##### 2. 製剤の組成

###### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

販売名	ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」	ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」
有効成分	1錠中： ベタキソロール塩酸塩 5mg 含有	1錠中： ベタキソロール塩酸塩 10mg 含有
添加物	カルメロース, ステアリン酸マグネシウム, トウモロコシデンプン, ヒドロキシプロピルセルロース, D-マンニトール, メタケイ酸アルミン酸マグネシウム	

###### (2) 添加物

(「IV. 2. (1) 有効成分 (活性成分) の含量」の項参照)

###### (3) その他

該当記載事項なし

##### 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<sup>1)</sup>

##### (1) 加速試験

加速試験（40℃， 75%RH， 6 ヶ月）の結果，ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」及びベ  
タキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」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。

##### ◇ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」 加速試験 [最終包装包装形態]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 ヶ月	4 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜割線入りの白色の素錠＞	7ELI	適合	適合	適合	適合
崩壊試験 ＜水， 30 分以内＞	7ELI	適合	適合	適合	適合
含量 (%) * ＜95.0～105.0%＞	7ELI	99.4	98.8	100.4	99.8

※：表示量に対する含有率 (%)

##### ◇ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」 加速試験 [最終包装包装形態]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 ヶ月	4 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜割線入りの白色の素錠＞	4NLI	適合	適合	適合	適合
崩壊試験 ＜水， 30 分以内＞	4NLI	適合	適合	適合	適合
含量 (%) * ＜95.0～105.0%＞	4NLI	98.7	99.2	100.8	99.6

※：表示量に対する含有率 (%)

## (2) 無包装の安定性試験

試験実施期間：2010/2/18～2010/6/1

◇ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」 無包装 40℃ [遮光・気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間	
		開始時	3 ヶ月
性状 n=3 <割線入りの白色の素錠>	882451	白色の片面 1/2 割線入りの素錠	白色の片面 1/2 割線入りの素錠
溶出性 (%) n=6 <15 分, 85%以上>	882451	92.6～95.9	93.8～98.6
含量 (%) * n=3 <95.0～105.0%>	882451	97.0～98.2	97.2～98.2
(参考値) 硬度 (kg) n=3	882451	7.3	8.0

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」 無包装 25℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間	
		開始時	3 ヶ月
性状 n=3 <割線入りの白色の素錠>	882451	白色の片面 1/2 割線入りの素錠	白色の片面 1/2 割線入りの素錠
溶出性 (%) n=6 <15 分, 85%以上>	882451	92.6～95.9	86.6～93.1
含量 (%) * n=3 <95.0～105.0%>	882451	97.0～98.2	98.0～98.2
(参考値) 硬度 (kg) n=3	882451	7.3	3.4

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」 無包装 曝光量 60 万 Lx・hr

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx・hr
性状 n=3 <割線入りの白色の素錠>	882451	白色の片面 1/2 割線入りの素錠	白色の片面 1/2 割線入りの素錠
溶出性 (%) n=6 <15 分, 85%以上>	882451	92.6～95.9	96.4～97.8
含量 (%) * n=3 <95.0～105.0%>	882451	97.0～98.2	98.7～99.0
(参考値) 硬度 (kg) n=3	882451	7.3	6.3

※：表示量に対する含有率 (%)

試験実施期間：2010/2/18～2010/6/1

◇ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」 無包装 40℃ [遮光・気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間	
		開始時	3 ヶ月
性状 n=3 <割線入りの白色の素錠>	882421	白色の片面 1/2 割線入りの素錠	白色の片面 1/2 割線入りの素錠
溶出性 (%) n=6 <15 分, 85%以上>	882421	93.7～95.0	96.1～97.2
含量 (%) * n=3 <95.0～105.0%>	882421	98.9～99.4	98.8～99.1
(参考値) 硬度 (kg) n=3	882421	7.0	5.3

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」 無包装 25℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間	
		開始時	3 ヶ月
性状 n=3 <割線入りの白色の素錠>	882421	白色の片面 1/2 割線入りの素錠	白色の片面 1/2 割線入りの素錠
溶出性 (%) n=6 <15 分, 85%以上>	882421	93.7～95.0	87.1～90.9
含量 (%) * n=3 <95.0～105.0%>	882421	98.9～99.4	100.0～100.3
(参考値) 硬度 (kg) n=3	882421	7.0	3.0

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」 無包装 曝光量 60 万 Lx・hr [気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx・hr
性状 n=3 <割線入りの白色の素錠>	882421	白色の片面 1/2 割線入りの素錠	白色の片面 1/2 割線入りの素錠
溶出性 (%) n=6 <15 分, 85%以上>	882421	93.7～95.0	94.0～96.4
含量 (%) * n=3 <95.0～105.0%>	882421	98.9～99.4	99.4～99.9
(参考値) 硬度 (kg) n=3	882421	7.0	6.0

※：表示量に対する含有率 (%)

## 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）溶出規格

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「NIG」及びベタキソロール塩酸塩錠 10mg「NIG」の溶出性は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

（試験液に溶出試験第2液 900mLを用い、パドル法により、50rpmで試験を行う）

#### 溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
5mg	15分	85%以上
10mg	15分	85%以上

### （2）溶出試験<sup>2)</sup>

＜ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「NIG」＞

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成13年5月31日医薬審発第786号）

#### 試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

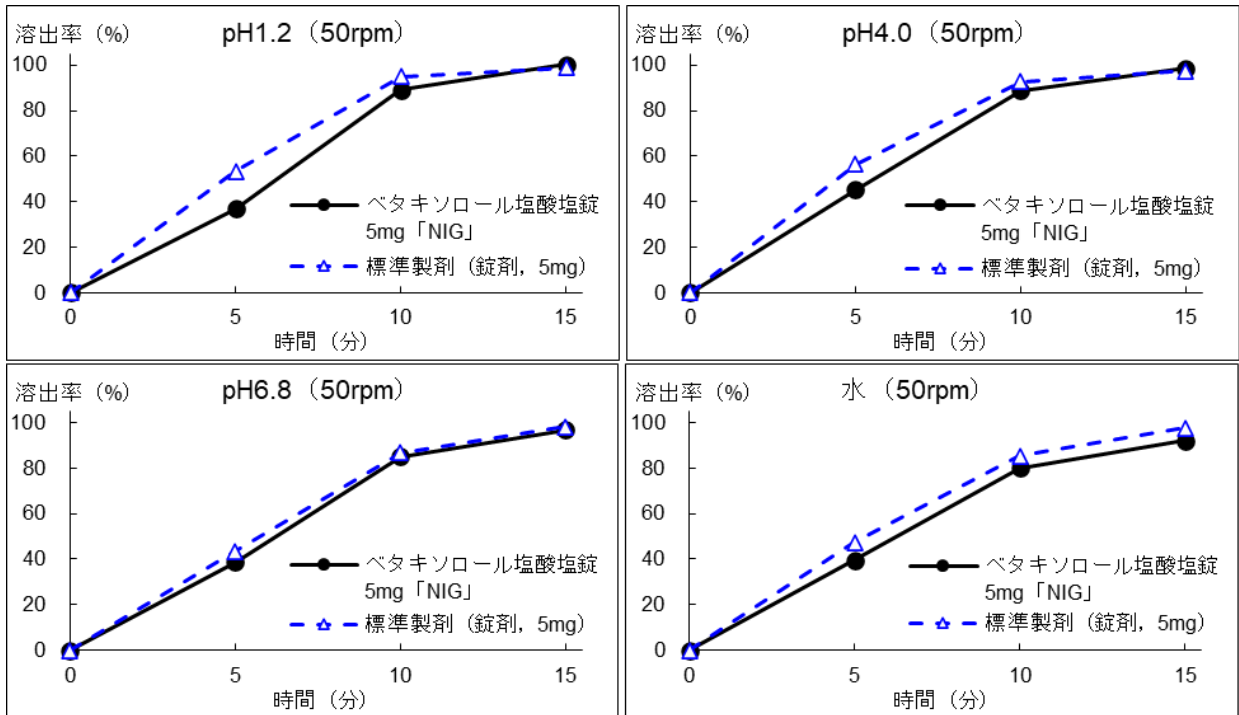
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水）

#### [判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH4.0（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ 水（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。

以上、ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「NIG」の溶出挙動を標準製剤（錠剤，5mg）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=6)

<ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 13 年 5 月 31 日 医薬審発第 786 号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

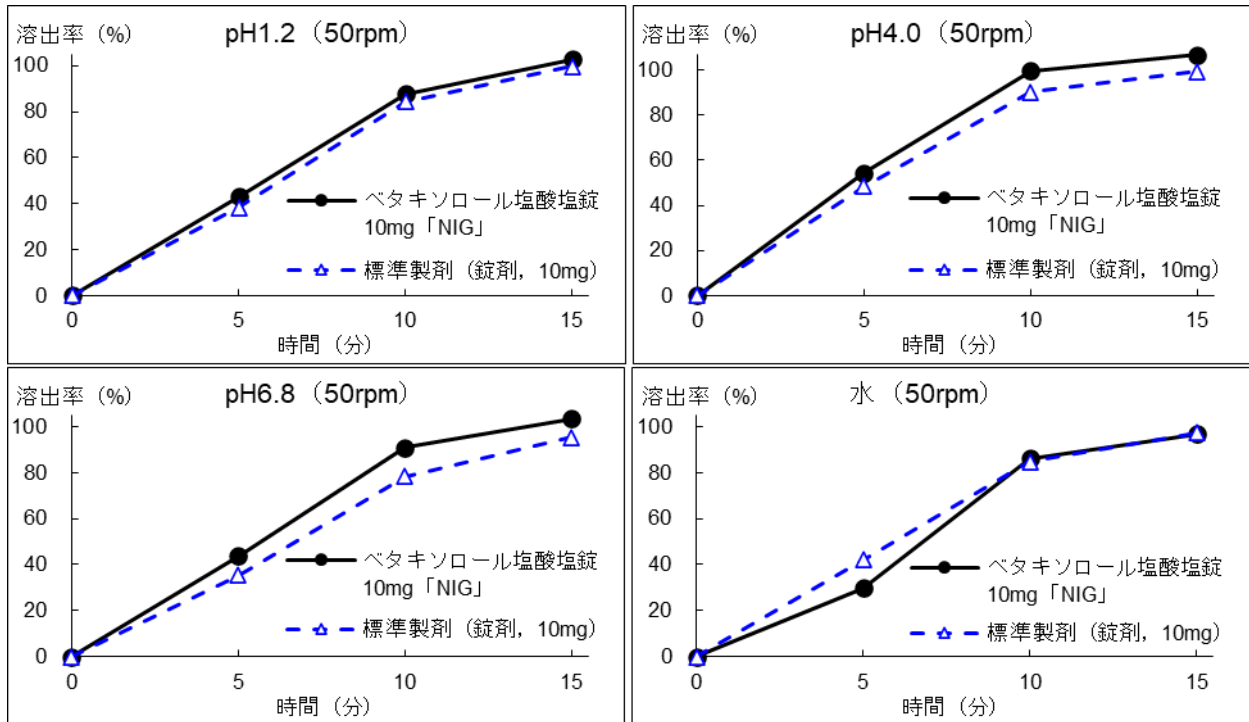
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ 水 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」の溶出挙動を標準製剤（錠剤, 10mg）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=6)

## 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

### (1) ドラーゲンドルフ試液による呈色反応

本品を粉末とし、ジェチルエーテル及び水酸化ナトリウム試液を加えて振り混ぜた後、遠心分離する。ジェチルエーテル層をろ紙にスポットし、ドラーゲンドルフ試液を噴霧するとき、スポットはだいたい色を呈する。

### (2) 紫外可視吸光度測定法

本品を粉末とし、メタノール (95) を加えて攪拌後、ろ過する。ろ液につき紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 274~278nm 及び 280~284nm に吸収の極大を示す。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：1-ペンタンスルホン酸ナトリウム、酢酸、アセトニトリル

## 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

なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

本態性高血圧症（軽症～中等症）

腎実質性高血圧症

狭心症

### 2. 用法及び用量

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5～10mg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20mg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5mg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10mg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10mg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20mgまでとする。

#### <効能又は効果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， $\alpha$ 遮断剤で初期治療を行った後に本剤を投与し，常に $\alpha$ 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

アテノロール、セリプロロール塩酸塩、ビソプロロールフマル酸塩、アセブトロール塩酸塩等の $\beta_1$ 受容体選択性 $\beta$ 遮断薬

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>3)</sup>

ベタキソロール塩酸塩は、アドレナリン $\beta_1$ 受容体の選択的遮断薬である。主として心臓での $\beta_1$ 受容体刺激効果を抑制する。降圧作用の主たる機序は、 $\beta_1$ 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。

#### (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

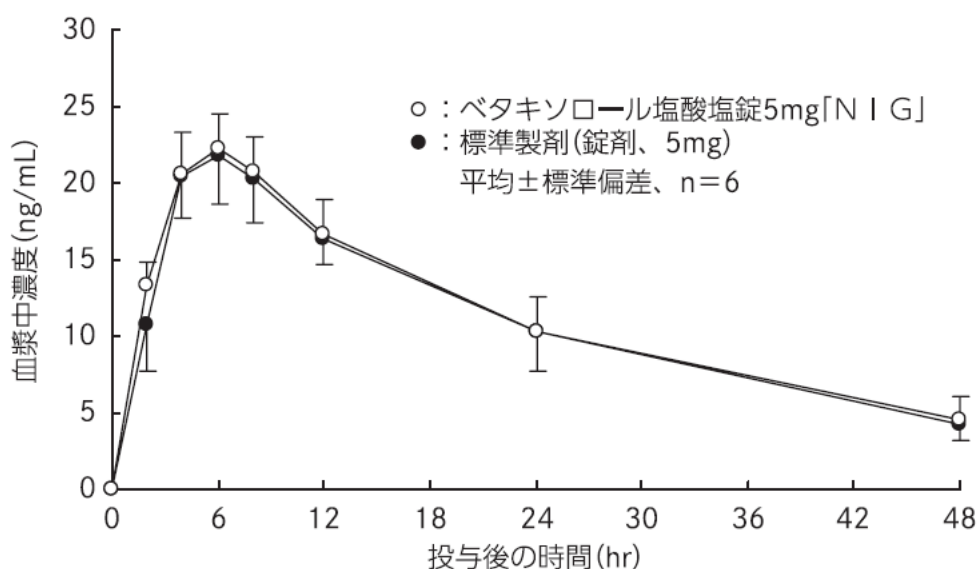
#### (2) 最高血中濃度到達時間

(「VII. 1. (3) 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<sup>4)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインについて(平成9年12月22日, 医薬審第487号)

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「NIG」と標準製剤を, クロスオーバー法によりそれぞれ2錠(ベタキソロール塩酸塩として10mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し, 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(0.80)~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。



#### [薬物速度論的パラメータ]

	投与量 (mg)	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC <sub>∞</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg「NIG」	10	548.6±88.3	22.5±2.1	5.7±1.5	19.1±2.8
標準製剤 (錠剤, 5mg)	10	534.9±84.1	22.5±2.8	5.3±1.0	18.7±2.5

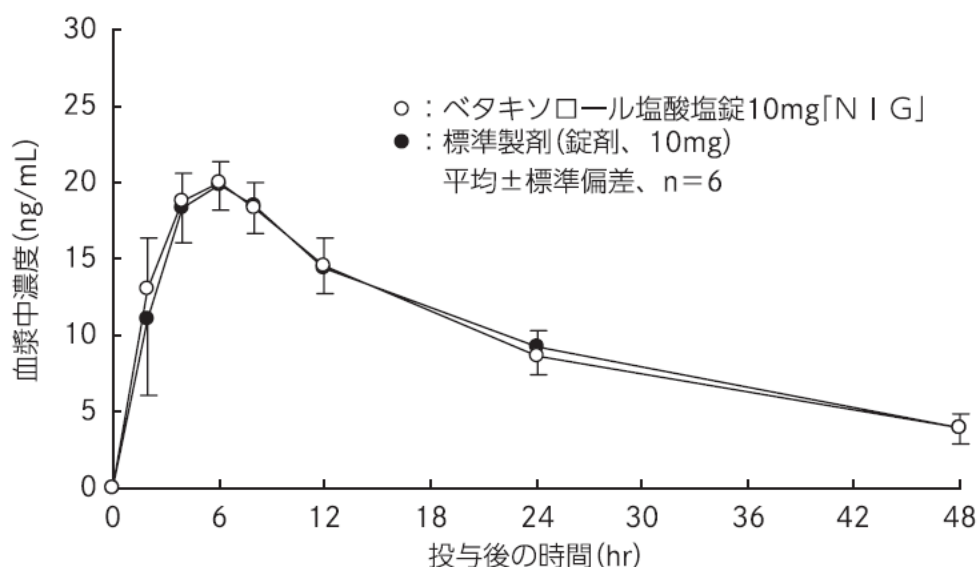
(2錠投与, Mean±S.D., n=6)

血漿中濃度並びに AUC, C<sub>max</sub> 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。

<ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「NIG」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインについて（平成9年12月22日，医薬審第487号）

ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「NIG」と標準製剤を，クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ベタキソロール塩酸塩として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。



[薬物速度論的パラメータ]

	投与量 (mg)	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC <sub>∞</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg「NIG」	10	477.9±55.5	20.0±1.3	5.7±0.8	19.1±2.8
標準製剤 (錠剤、10mg)	10	480.2±58.7	20.4±1.7	5.7±0.8	18.9±2.4

(1錠投与，Mean±S.D.，n=6)

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**

(「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照)

**(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<sup>5)</sup>**

経口による利用率：～80%

**(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<sup>5)</sup>**

50%

**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<sup>1)</sup>

主な代謝経路はイソプロピルアミノプロポキシ基の *N*-脱アルキル化と、シクロプロピルメトキシエチル基の *O*-脱アルキル化及びこれに続く酸化である。

### (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<sup>1)</sup>

健常成人に 10mg 及び 20mg 経口投与したとき、72 時間後までの尿中排泄率は 55～58% であり、そのうち未変化体 26～27% である。本態性高血圧症患者に 5mg を経口投与したとき、48 時間後までの尿中未変化体排泄率は約 16% である。

### (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

該当記載事項なし

### 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婦人（「妊婦，産婦，授乳婦等への投与」の項参照）

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当記載事項なし

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

（「Ⅴ. 治療に関する項目」の項参照）

### 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]（「重要な基本的注意とその理由及び処置方法」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

- (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、 $\beta$ 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。 $\beta$ 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 $\alpha_2$ 受容体に選択的に作用し、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 $\beta$ 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、 $\beta$ 受容体刺激作用が遮断され、 $\alpha$ 受容体刺激作用だけが残り、急激な血圧上昇が起こる。

**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
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 アミオダロン塩酸塩 等	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（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

	頻度不明
循環器	徐脈, 低血圧, 動悸, 胸痛, 心電図異常, 房室ブロック, レイノー現象, 洞停止
眼	目のちらつき, 涙液分泌減少 <sup>注1)</sup> , 霧視 (感) <sup>注1)</sup>
過敏症 <sup>注2)</sup>	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), ALT (GPT), Al-P, $\gamma$ -GTP, LDH上昇等]
呼吸器	呼吸困難, 喘息症状
腎臓	BUN上昇
その他	倦怠感, 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1) 他の $\beta$ 遮断剤で報告されている。

注2) 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

- 1) **禁忌**: 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) **その他の副作用**: 過敏症 (発疹, 蕁麻疹, そう痒) 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

高齢者に使用する場合は, 低用量 (例えば高血圧症では 2.5mg, 狭心症では 5mg) 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

- (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。 [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

該当記載事項なし

### 13. 過量投与

- (1) **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。
- (2) **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、ノルアドレナリンなど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β<sub>1</sub>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<sub>2</sub>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

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)

### 15. その他の注意

該当記載事項なし

### 16. その他

該当記載事項なし

## 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）

(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	ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」 ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」	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	ベタキソロール塩酸塩	劇薬

### 2. 有効期間又は使用期限

外装に表示の使用期限内に使用すること。（3年：安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

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

特になし

#### （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）

くすりのしおり：有

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目」の項参照）

#### （3）調剤時の留意点について

該当記載事項なし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」：PTP包装；100錠（10錠×10）

ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」：PTP包装；100錠（10錠×10）

### 7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニルフィルム，アルミニウム箔

ピロー：アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

### 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：アテノロール，セリプロロール塩酸塩，ビソプロロールフマル酸塩，アセブトロール塩酸塩等

### 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	製造承認年月日	承認番号
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」	2013年7月22日	22500AMX01308000
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」	2013年7月22日	22500AMX01307000

旧販売名	製造承認年月日	承認番号
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「武田テバ」	2013年7月22日	22500AMX01308000
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「武田テバ」	2013年7月22日	22500AMX01307000

旧販売名	製造承認年月日	承認番号
アロング錠 5mg	2002年2月25日	21400AMZ00110000
アロング錠 10mg	2002年2月25日	21400AMZ00111000

**11. 薬価基準収載年月日**

販売名	薬価基準収載年月日
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」	2023年8月30日
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」	2023年8月30日

旧販売名	薬価基準収載年月日
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「武田テバ」	2016年12月9日
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「武田テバ」	2016年12月9日

旧販売名	製造承認年月日
アロング錠 5mg	2002年7月5日
アロング錠 10mg	2002年7月5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**

＜再評価結果（品質再評価）＞

結果公表日：2005年10月13日

結果：薬事法第14条第2項各号（承認拒否自由）のいずれにも該当しない

**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，投薬期間に関する制限は定められていない。

**16. 各種コード**

販売名	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト電算 コード	HOT（9桁） コード
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」	2149031F1019 (統一収載コード)	621469504	114695004
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」	2149031F2015 (統一収載コード)	621469804	114698104

旧販売名	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト電算 コード	HOT（9桁） コード
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「武田テバ」	2149031F1019 (統一収載コード)	621469501	114695003
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「武田テバ」	2149031F2015 (統一収載コード)	621469801	114698103

**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) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) 第十八改正日本薬局方解説書 C-5161, 廣川書店, 東京 (2018)
- 3) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 4) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (生物学的同等性試験)
- 5) グッドマン・ギルマン薬理書 -薬物治療の基礎と臨床- 第12版, 廣川書店 (2013)

### **2. その他の参考文献**

なし

## X II. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

効能又は効果	用法及び用量
本態性高血圧症（軽症～中等症） 腎実質性高血圧症 狭心症領域における解熱・鎮痛	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5～10mg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20mg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5mg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10mg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10mg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20mgまでとする。

<DailyMed (USA) 、2023年7月検索>

国名	米国
会社名	KVK-TECH, INC.
販売名	BETAXOLOL HYDROCHLORIDE tablet, coated
剤形・規格	10mg, 20mg
<b>INDICATIONS AND USAGE</b>	
Betaxolol tablets, USP is indicated in the management of hypertension. It may be used alone or concomitantly with other antihypertensive agents, particularly thiazide-type diuretics.	
<b>DOSAGE AND ADMINISTRATION</b>	
The initial dose of betaxolol tablets, USP in hypertension is ordinarily 10 mg once daily either alone or added to diuretic therapy. The full antihypertensive effect is usually seen within 7 to 14 days. If the desired response is not achieved the dose can be doubled after 7 to 14 days. Increasing the dose beyond 20 mg has not been shown to produce a statistically significant additional antihypertensive effect; but the 40-mg dose has been studied and is well tolerated. An increased effect (reduction) on heart rate should be anticipated with increasing dosage. If monotherapy with betaxolol tablets, USP does not produce the desired response, the addition of a diuretic agent or other antihypertensive should be considered.	
Dosage Adjustments For Specific Patients:	
<i>Patients with renal failure:</i>	
In patients with renal impairment, clearance of betaxolol declines with decreasing renal function.	
In patients with severe renal impairment and those undergoing dialysis, the initial dose of betaxolol tablets, USP is 5 mg once daily. If the desired response is not achieved, dosage may be increased by 5 mg/day increments every 2 weeks to a maximum dose of 20 mg/day.	
<i>Patients with hepatic disease:</i>	
Patients with hepatic disease do not have significantly altered clearance. Dosage adjustments are not routinely needed.	

*Elderly patients:*

Consideration should be given to reduction in the starting dose to 5 mg in elderly patients. These patients are especially prone to beta-blocker-induced bradycardia, which appears to be dose related and sometimes responds to reductions in dose.

**Cessation of therapy:**

If withdrawal of betaxolol tablets, USP therapy is planned, it should be achieved gradually over a period of about 2 weeks. Patients should be carefully observed and advised to limit physical activity to a minimum.

## 2. 海外における臨床支援情報

### 妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意の項の記載とオーストラリア分類とは異なる。

	Drug Name	Category
オーストラリアの分類	betaxolol	C

(2023年7月検索)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類（An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）

Category C：

Drugs which, owing to their pharmacological effects, have caused or may be suspected of causing, harmful effects on the human fetus or neonate without causing malformations. These effects may be reversible. Accompanying texts should be consulted for further details.



### 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。

#### (1) 粉砕

##### 粉砕物の安定性試験

##### ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」

粉砕物の安定性を 40℃及び 60 万 Lx・hr の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は開始時白色の粉末であり、2 週間後一部塊が認められた。含量は規格内であった。

検体作成方法：試験製剤を乳鉢で粉砕した。

試験実施期間：2010/3/17～2010/4/23

##### ● 粉砕物 40℃ [遮光・気密容器]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間		
		開始時	2 週	4 週
性状	882451	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <95.0～105.0%>	882451	99.3～99.4	99.4～99.9	99.0～99.4

※：表示量に対する含有率 (%)

##### ● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光・開放]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間		
		開始時	2 週	4 週
性状	882451	白色の粉末	白色の粉末 一部塊※1	白色の粉末 一部塊※1
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	882451	99.3～99.4	99.2～99.6	99.5～99.7

※1：塊は固化しておらず、軽く押すことで粉末となった

※2：表示量に対する含有率 (%)

##### ● 粉砕物 曝光量 60 万 Lx・hr

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx・hr
性状	882451	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <95.0～105.0%>	882451	99.3～99.4	98.7～99.0

※：表示量に対する含有率 (%)

## ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」

粉砕物の安定性を 40℃及び 60 万 Lx・hr の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は開始時白色の粉末であり、2 週間後一部塊が認められた。含量は規格内であった。

検体作成方法：試験製剤を乳鉢で粉砕した。

試験実施期間：2010/3/17～2010/4/23

### ● 粉砕物 40℃ [遮光・気密容器]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間		
		開始時	2 週	4 週
性状	882421	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <95.0～105.0%>	882421	99.9～100.2	99.3～99.5	99.4～99.7

※：表示量に対する含有率 (%)

### ● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光・開放]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間		
		開始時	2 週	4 週
性状	882421	白色の粉末	白色の粉末 一部塊※1	白色の粉末 一部塊※1
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	882421	99.9～100.2	99.5～100.2	99.4～100.0

※1：塊は固化しておらず、軽く押すことで粉末となった

※2：表示量に対する含有率 (%)

### ● 粉砕物 曝光量 60 万 Lx・hr

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx・hr
性状	882421	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <95.0～105.0%>	882421	99.9～100.2	99.3～99.6

※：表示量に対する含有率 (%)

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

### ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐときのチューブ内の残存物の有無にて通過性を観察した。

ロット番号：882451

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
ベタキソロール塩酸塩錠 5mg 「NIG」	10 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（株）じほう」に準じて実施しました。

## ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」

### 1) 試験方法

#### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55°C の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

#### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐときのチューブ内の残存物の有無にて通過性を観察した。

ロット番号：882421

### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
ベタキソロール塩酸塩錠 10mg 「NIG」	10 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（株）じほう」に準じて実施しました。

## 2. その他の関連資料

なし