

△メリスロン錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】ベタヒスチンメシル酸塩 Betahistine Mesilate 【分類】めまい・平衡障害治療剤

【単位】△6mg・▼12mg/錠

【常用量】1回6～12mg, 1日3回■亜急性期のめまいには36mg/日

【用法】分3(食後)

【透析患者への投与方法】尿中排泄率が高いため減量が必要と思われるが、腎不全患者に関する薬物動態に関する報告、透析患者に対して使用したという報告がない(5) 一方、ADHDへの高用量適用(～200mg/日)において安全性に問題がないという報告(Moorthy G, et al: Biopharm Drug Dispos 2015 PMID: 25904220)もあり、透析患者においてめまいに対する常用量が適用できる可能性がある(5)

【保存期CKD患者への投与方法】適正量は不明(5)

【特徴】ヒスタミン類似作用を有するH1, H3アンタゴニスト。内耳毛細管の透過性を増すことにより、内リンパ水腫を防ぐ。メニエル病、メニエル症候群、眩暈症に伴うめまい、めまい感に適用。ヒスタミン作用による胃酸分泌促進(H2)、気道収縮(H1)の可能性もある。

【主な副作用・毒性】悪心・嘔吐、過敏症など

【吸収】100% [塩酸塩] (11)

【F】100%, 初回通過効果を受けない(11) 初回通過効果を受ける(Chen XY, et al: Xenobiotica 33: 1261-71, 2003 PMID: 14765546)

MAO-B阻害剤のセレギリン併用でFが上昇(Strupp M, et al: Front Neurol 2023 PMID: 37920833)

【tmax】1hr [塩酸塩, 空腹時] (11)

【代謝】代謝物として2-pyridylacetic acidと2-(2-aminoethyl)pyridineが同定されている[塩酸塩] (11) 主代謝物2-pyridylacetic acid (2-PAA) (Moorthy G, et al: Biopharm Drug Dispos 2015 PMID: 25904220) 代謝物に活性があるというデータはないが、2-PAAの作用や動態について検証が必要(Chen XY, et al: Xenobiotica 2003 PMID: 14765546) 肝でアミノエチルピリジン[M1], ヒドロキシエチルピリジン[M2]に代謝され、尿中にはピジリル酢酸として排泄される(Botta L, et al: Acta Otolaryngol 120: 25-7, 2000 PMID: 10779181)

抗めまい活性はまず未変化体によりもたらされ、次いでM1が関与していると推測(Botta L, et al: Acta Otorhinolaryngol Ital 2001 PMID: 11677836)

【排泄】85～90%が尿中に排泄され、胆汁排泄は未変化体、代謝物ともに重要な経路ではない(11) 経口投与時の尿中回収率10～30%、糞便中回収率50～70% [ラット, 24hrまで] (1) 代謝物グルクロン酸抱合体が尿中に回収 [ラット] (1)

【t1/2】3.5hr [塩酸塩] (11) 5.2hr (Chen XY, et al: Xenobiotica 2003 PMID: 14765546)

【蛋白結合率】0～5% [塩酸塩] (11)

【MW】328.41, 209.2 (free base)

【透析性】不明(5)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない

【薬物動態】200mgまで線形(Moorthy G, et al: Biopharm Drug Dispos 2015 PMID: 25904220)

【O/W係数】0.1未満(塩酸塩) (11) 資料なし(1) 【pKa】3.20, 9.62 (1)

【相互作用】抗ヒスタミン薬との併用については記載なし(1)

【主な臨床報告】4週間の治療によるめまいによる諸症状改善効果はジフェニドールに劣る(松田和徳, 他: 耳鼻と臨床 59: 115-21, 2013)

24～48mg/日でめまいの重症度の緩和効果がなく、QOL、聴力の変化もプラセボと有意な差がない[BEMED trial] (Adrion C, et al: BMJ 2016 PMID: 26797774)

末梢性めまいに48mg/日適用は治療選択肢(Ramos Alcocer R, et al: Acta Otolaryngol 2015 PMID: 26245698)

抗精神病治療における体重増加対策に有用(Kang D, et al: Front Psychiatry 2018 PMID: 30542300)

一次性耳鳴りには効果を認めず(Castilho GL, et al: Clin Otolaryngol 2023 PMID: 36320174)

系統的レビューではメニエル症状に効果を認めず(Van Esch B, et al: Audiol Neurootol. 2022 PMID: 34233329, van Esch BF, et al: BMJ Evid Based Med 2022 PMID: 34750154)

難聴・耳鳴を主徴とする蝸牛性メニエルへの長期適用は聴力に対して良好な効果をもたらした(Cheng PC, et al: Acta Otolaryngol 2024 PMID: 39008429)

BPPVに対する耳石再配置法へのベタヒスチン追加のメリットはない(Erdur ZB, et al: Niger J Clin Pract 2023 PMID: 37794554)

片側前庭障害への高用量(72mg/日)適用が有効な例はある(Takeda N, et al: Auris Nasus Larynx 2024 PMID: 37666746)

【備考】ADHDへの適用が検証されている(Moorthy G, et al: Biopharm Drug Dispos 36: 429-39, 2015 PMID: 25904220)

H3受容体への逆作動薬として作用(Gbahou F, et al: J Pharmacol Exp Ther 2010 PMID: 20530654)

【更新日】20240821

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国特許法並びに国際条約により保護されています。