

△ビラノア錠・▼OD錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】ピラスチン Bilastine 【分類】抗ヒスタミン薬

【単位】△20mg/錠・OD錠

【常用量】20mg/日

6～11歳の小児には10mg/日が適切 (Rodriguez M, et al: Eur J Pediatr 2020 PMID: 31919579)

高齢者でも20mgでよい (Kim C, et al: CPT Pharmacometrics Syst Pharmacol 2021 PMID: 34157202)

【用法】1日1回、空腹時

食後投与で血中濃度は低下するが、臨床効果には影響しなかった (Coimbra J, et al: Int Arch Allergy Immunol 2022 PMID: 35700691)

【透析患者への投与方法】AUCが増大する可能性があり慎重に投与 (1)

【その他の報告】GFR 30mL/min未満の患者でAUCが2.3倍に上昇 (1) 吸収が安定するなら食後投与も選択できる可能性、隔日投与も選択できる可能性 (5)

【保存期CKD患者への投与方法】中等度又は重度の腎機能障害患者では血中薬物濃度が上昇するおそれがあるため慎重投与 (1)

【その他の報告】腎機能低下によりAUCは増大するが、安全性に問題のない範囲であり、20mg/日が適用できる (Lasseter KC, et al: Clin Drug Investig 33: 665-73, 2013 PMID: 23873362) GFR 30mL/min未満の患者でAUCが2.3倍に上昇 (1)

【特徴】選択的ヒスタミンH1受容体拮抗薬。中枢抑制作用が弱い。吸収が食事の影響を受けるので原則空腹時投与。

【主な副作用・毒性】眠気、頭痛、めまい、口渇、下痢、腹痛、QT延長、頻脈、動悸、呼吸困難、鼻乾燥、疲労など

【安全性に関する情報】主観的な鎮静作用は40mgで、客観的な鎮静作用は80mgでもたらされた (Garcia-Gea C, et al: J Clin Psychopharmacol 2008 PMID: 19011437) 自動車運転テストでも悪影響を及ぼさない (Conen S, et al: J Psychopharmacol 2011 PMID: 20855350)

）高用量でも心再分極に影響しない (Graff C, et al: Clin Drug Investig 2012 PMID: 22393898)

過量投与時の症状は、めまい、頭痛、悪心が報告 (1) 慢性蕁麻疹患者での主な副作用は頭痛3.6%、眠気1.0% (Yagami A, et al: J Dermatol 2016 PMID: 27862227)

副作用発現頻度はプラセボと変わらず (Togawa M, et al: Clin Drug Investig 2016 PMID: 27498100)

【吸収】食後投与でAUCが40%、Cmaxが60%低下 (1) P-gp阻害剤により吸収率が増大するおそれ (1)

【F】60.67% (1) 60% (Sadaba B, et al: Clin Drug Investig 33: 375-81, 2013 PMID: 23529786)

【tmax】1hr (1) tmaxは1hrで、Emaxは4hr (Jauregizar N, et al: Clin Pharmacokinetics 48: 543-54, 2009 PMID: 19705924) 1.31hr (Sadaba B, et al: Clin Drug Investig 33: 375-81, 2013 PMID: 23529786) 1～1.5hr (Togawa M, et al: Clin Drug Investig 36: 1011-21, 2016 PMID: 27498100)

【代謝】ほとんど代謝されない (1) わずかに生成する水酸化体への代謝はCYP3A4が関与 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率66% [iv, 72hrまで]、47.3% [po, 72hrまで] (1) 尿中回収率33～47% (1) P-gp, OATP1A2の基質 (1)

【CL/F】16.23±6.31L/hr (1) 腎機能正常者30L/hr、軽度腎障害患者20L/hr、中等度以上腎障害患者15L/hrで、GFRと相関 (Lasseter KC, et al: Clin Drug Investig 33: 665-73, 2013 PMID: 23873362) 肝クリアランスの蓄与率34% (1)

【腎CL】腎機能正常者8.7L/hr、軽度腎障害患者6.9L/hr、中等度腎障害患者5.5L/hr、高度腎障害患者4L/hr (Lasseter KC, et al: Clin Drug Investig 33: 665-73, 2013 PMID: 23873362)

【t1/2】10～13hr (1)

【蛋白結合率】84～90% (1)

【Vd/F】220～460L/man (Lasseter KC, et al: Clin Drug Investig 33: 665-73, 2013 PMID: 23873362) 286±243L/man (1)

【MW】463.61

【透析性】透析性は低いと思われる (5) 資料なし (1)

【薬物動態】2-コンパートメントモデルで解析され、20mg/日にてほぼ持続してIC50値を上回る (Jauregizar N, et al: Clin Pharmacokinetics 48: 543-54, 2009 PMID: 19705924) 10～50mgの範囲で線形 (Togawa M, et al: Clin Drug Investig 36: 1011-1021, 2016 PMID: 27498100)

【O/W係数】

【相互作用】P-gp阻害剤により吸収率増大 (消化管への分泌抑制) のおそれ (1) ケトコナゾール併用でQT延長 (Tyl B, et al: J Clin Pharmacol 52: 893-903, 2012 PMID: 21642470) BCRP, OAT1, OAT3, OCT2関連の相互作用を受けにくい、P-gp関連の相互作用は受ける可能性がある (Lucero ML, et al: Drug Chem Toxicol 35 Suppl 1: 8-17, 2012 PMID: 22616811)

CYP関連の相互作用を受けない (Lucero ML, et al: Drug Chem Toxicol 2012 PMID: 22616812)

MDR1を除きトランスポーター関連の相互作用の可能性は低い (Lucero ML, et al: Drug Chem Toxicol 2012 PMID: 22616811)

【主な臨床報告】ヒスタミンH1受容体に選択性が高く、抗炎症作用を併せ持つ (Corcostegui R, et al: Drugs R D 2005 PMID: 16274260)

抗ヒスタミン作用はセチリジンと同レベルでフェキソフェナジンより強い (Corcostegui R, et al: Drugs R D 2006 PMID: 16784247)

20mg/日は季節性アレルギー性鼻炎に対して、デスロラタジン5mgと同等の効果 (Bachert C, et al: Allergy 2008 PMID: 19132976)

20mg/日は季節性アレルギー性鼻炎に対してセチリジン10mgと同等の効果があり安全性はより優れる (Kuna P, et al: Clin Exp Allergy 2009 PMID: 19438584) 20mg/日は突発性蕁麻疹に対してレボセチリジン5mgと同等の効果があり安全性はプラセボと同等 (Zuberbier T, et al: Allergy 2010 PMID: 19860762)

花粉症に対してフェキソフェナジンより持続的に効果を示す (Horak F, et al: Inflamm Res 2010 PMID: 19943178)

皮膚紅斑への効果出現はセチリジンよりも速い (Church MK: Inflamm Res 2011 PMID: 21874559)

継続投与による慢性アレルギー性鼻炎に対する効果は1年後でも持続して認められた (Sastre J, et al: Curr Med Res Opin 2012 PMID: 22077106)

アレルギー性結膜炎に対してレボセチリジンと同等の効果 (Bartra J, et al: J Investig Allergol Clin Immunol 2011 PMID: 22185047)

寒冷蕁麻疹には80mg/日まで効果が増強する (Krause K, et al: Allergy 2013 PMID: 23742030)

難治性蕁麻疹や蕁麻疹には80mgに増量して適用 (Church MK, et al: J Eur Acad Dermatol Venereol 2017 PMID: 28467671)

【更新日】20230316

※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、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。