


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 2018(2019年更新版)に準拠して作成

アレルギー性疾患治療剤
ビラスチン口腔内崩壊錠

ビラスチンOD錠20mg「タカタ」

Bilastine OD Tablets “TAKATA”

剤形	錠剤(口腔内崩壊錠)	
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	1錠中 ビラスチン 20mg	
一般名	和名: ビラスチン(JAN) 洋名: Bilastine(JAN、INN)	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日	2026年2月16日
	薬価基準収載年月日	2026年6月12日
	販売開始年月日	2026年6月12日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元: 高田製薬株式会社 販売元: 日本ジェネリック株式会社	
医薬情報担当者 の連絡先		
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室  : 0120-893-170 FAX 番号: 0120-893-172 医療関係者向けホームページ https://medical.nihon-generic.co.jp/	

本IFは2026年2月作成(第1版)の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の電子添文等の情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

また、専用アプリ「添文ナビ®」(®:登録商標)で以下のGS1バーコードを読み取ることで同様の情報を閲覧できます。



(01)14987792104334

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

-日本病院薬剤師会-

(2020年4月改訂)

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)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り、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目	
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的特性	1
3. 製品の製剤学的特性	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1
6. RMPの概要	1
II. 名称に関する項目	
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名(命名法)又は本質	2
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	2
III. 有効成分に関する項目	
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法, 定量法	3
IV. 製剤に関する項目	
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 添付溶解液の組成及び容量	5
4. 力価	5
5. 混入する可能性のある夾雑物	5
6. 製剤の各種条件下における安定性	5
7. 調製法及び溶解後の安定性	10
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	10
9. 溶出性	10
10. 容器・包装	12
11. 別途提供される資材類	12
12. その他	12
V. 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	13
2. 効能又は効果に関連する注意	13
3. 用法及び用量	13
4. 用法及び用量に関連する注意	13
5. 臨床成績	13
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	17
2. 薬理作用	17
VII. 薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移	18
2. 薬物速度論的パラメータ	21
3. 母集団(ポピュレーション)解析	21
4. 吸収	22
5. 分布	22
6. 代謝	22
7. 排泄	23
8. トランスポーターに関する情報	23
9. 透析等による除去率	23
10. 特定の背景を有する患者	24
11. その他	24
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	25
2. 禁忌内容とその理由	25
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	25
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	25
5. 重要な基本的注意とその理由	25
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	25
7. 相互作用	26
8. 副作用	26
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	27
10. 過量投与	27
11. 適用上の注意	27
12. その他の注意	27
IX. 非臨床試験に関する項目	
1. 薬理試験	28
2. 毒性試験	28
X. 管理的事項に関する項目	
1. 規制区分	29
2. 有効期間	29
3. 包装状態での貯法	29
4. 取扱い上の注意	29
5. 患者向け資材	29
6. 同一成分・同効薬	29
7. 国際誕生年月日	29
8. 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価基準 収載年月日, 販売開始年月日	29
9. 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	29
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその 内容	29
11. 再審査期間	30
12. 投薬期間制限に関する情報	30
13. 各種コード	30
14. 保険給付上の注意	30
XI. 文献	
1. 引用文献	31
2. その他の参考文献	32
XII. 参考資料	
1. 主な外国での発売状況	33
2. 海外における臨床支援情報	33
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	34
2. その他の関連資料	36

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ビラスチン OD 錠 20mg「タカタ」は高田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、2026年2月に承認を取得した。

2. 製品の治療学的特性

効能・効果として以下の適応がある。（「V. 1. 効能又は効果」の項参照）

○アレルギー性鼻炎

○蕁麻疹

○皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒

重大な副作用としてショック、アナフィラキシーが報告されている。

（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

服薬アドヒアランス向上にこだわった OD 錠

・水なしで服用できる小型化 OD 錠

（「VII. 1. (2) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照）

・特徴の異なる2種類の甘味料を配合

（「IV. 2. (1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤」の項参照）

・有効成分の味に合わせたグレープ風味

（「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照）

・視認性に配慮した両面インクジェット印字

（「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照）

4. 適正使用に関して周知すべき特性

該当しない

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当資料なし

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」

(2) 洋名

Bilastine OD Tablets 20mg “TAKATA”

(3) 名称の由来

一般名による

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

ビラスチン(JAN)

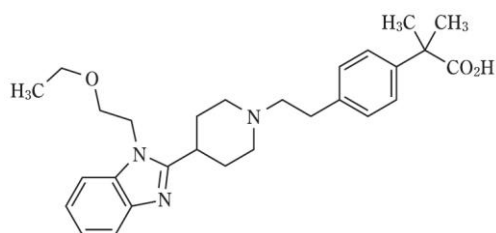
(2) 洋名(命名法)

Bilastine(JAN、INN)

(3) ステム(stem)

抗ヒスタミン薬: -astine (x)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: C₂₈H₃₇N₃O₃

分子量: 463.61

5. 化学名(命名法)又は本質

2-[4-(2-{4-[1-(2-Ethoxyethyl)-1*H*-benzimidazol-2-yl]piperidin-1-yl}ethyl)phenyl]-2-methylpropanoic acid

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。結晶多型が認められる。

(2) 溶解性

水及びアセトニトリルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

該当資料なし

(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

該当資料なし

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, 定量法

確認試験法：赤外吸収スペクトル測定法

定量法：液体クロマトグラフィー



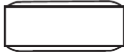
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

錠剤(口腔内崩壊錠)

(2) 製剤の外観及び性状

性状	外形		
	表面 直径	裏面 重さ	側面 厚さ
白色の裸錠	 約 7.0mm	 約 0.13g	 約 2.8mm

※香料によりグレープ風味をつけている

(3) 識別コード

	ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」
識別コード	ビラスチン OD 20 タカタ
記載場所	錠剤

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

有効成分	添加剤
1 錠中 ビラスチン 20mg	D-マンニトール、結晶セルロース、クロスポビドン、ヒドロキシプロピルセルロース、アセスルファムカリウム、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、フマル酸ステアリルナトリウム、香料、プロピレングリコール

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

(1) 加速試験

下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(3 ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
40℃ 75%RH / PTP 包装 (PTP/紙箱)	6 箇月	性状	白色の裸錠	白色の裸錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		崩壊性(秒)	15-18	14-17
		溶出性	88.2-94.6	88.3-95.3
		定量法	99.71-100.04	100.34-100.53
		純度試験	適	適
		水分	0.78-0.87	1.68-1.69

(2) 苛酷試験(承認申請時の試験結果)

評価基準

【外観】

分類	評価基準	判定
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	◎
変化あり(規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合	○
変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合	△

【溶出性】又は【崩壊性】

分類	評価基準	判定
変化なし	規格値内の場合	◎
変化あり(規格外)	規格値外の場合	△

【含量】

分類	評価基準	判定
変化なし	含量低下が3%未満の場合	◎
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合	○
変化あり(規格外)	規格値外の場合	△

【その他の試験項目】

分類	評価基準	判定
変化なし	規格値内の場合	◎
変化あり(規格外)	規格値外の場合	△

平成11年8月20日付「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(日本病院薬剤師会)一部改変

無包装状態の安定性

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	試験項目	結果		
		試験 開始時	1 箇月	3 箇月
60℃ 遮光 / 開放	外観	白色の裸錠	白色の裸錠	
	判定	◎	◎	
	確認試験 (判定)	◎	◎	
	崩壊性(秒)	14	19-20	17-20
	判定	◎	◎	◎
	溶出性(%)	88.9-92.3	85.0-91.8	87.1-90.2
	判定	◎	◎	◎
	含量(%)	100.19	100.13	100.05
	判定	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	◎	◎	
	水分(%)	1.25	0.79	1.01
25℃ 85%RH 遮光 / 開放	外観	白色の裸錠	白色の裸錠	
	判定	◎	◎	
	確認試験 (判定)	◎	◎	
	崩壊性(秒)	14	13-15	18-27
	判定	◎	◎	◎
	溶出性(%)	88.9-92.3	84.7-88.5	82.6-86.4
	判定	◎	◎	◎
	含量(%)	100.19	100.95	100.46
	判定	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	◎	◎	
	水分(%)	1.25	1.52	2.17

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

表 3

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	試験項目	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
3000 lx / 開放	外観	白色の裸錠	白色の裸錠	
	判定	◎	◎	
	確認試験 (判定)	◎	◎	
	崩壊性(秒)	14	15	14-15
	判定	◎	◎	◎
	溶出性(%)	88.9-92.3	87.9-95.1	89.5-93.4
	判定	◎	◎	◎
	含量(%)	100.19	100.02	100.05
	判定	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	◎	◎	
	水分(%)	1.25	0.88	0.94

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

PTP 状態の安定性

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 4

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	試験項目	結果		
		試験 開始時	1 箇月	3 箇月
60℃ 遮光 / PTP	外観	白色の裸錠	白色の裸錠	
	判定	◎	◎	
	確認試験 (判定)	◎	◎	
	崩壊性(秒)	14	19-21	16-17
	判定	◎	◎	◎
	溶出性(%)	88.9-92.3	85.2-91.8	84.3-88.6
	判定	◎	◎	◎
	含量(%)	100.19	99.81	101.10
	判定	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	◎	◎	
	水分(%)	1.25	0.75	0.97
25℃ 85%RH 遮光 / PTP	外観	白色の裸錠	白色の裸錠	
	判定	◎	◎	
	確認試験 (判定)	◎	◎	
	崩壊性(秒)	14	12-13	10-11
	判定	◎	◎	◎
	溶出性(%)	88.9-92.3	89.1-93.8	88.6-91.5
	判定	◎	◎	◎
	含量(%)	100.19	100.75	100.55
	判定	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	◎	◎	
	水分(%)	1.25	1.25	1.69

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

表 5

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	試験項目	結果		
		試験開始時	60万 lx・hr	120万 lx・hr
3000 lx / PTP	外観	白色の裸錠	白色の裸錠	
	判定	◎	◎	
	確認試験 (判定)	◎	◎	
	崩壊性(秒)	14	14-17	14-15
	判定	◎	◎	◎
	溶出性(%)	88.9-92.3	88.1-96.0	89.1-95.5
	判定	◎	◎	◎
	含量(%)	100.19	100.94	100.11
	判定	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	◎	◎	
	水分(%)	1.25	1.06	1.14

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当しない

9. 溶出性²⁾

「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」(令和2年3月19日薬生薬審発0319第1号)に従って試験を行ったところ、すべての試験条件においてガイドラインに示された基準に適合し、本剤と標準製剤の溶出挙動の類似性が確認された。溶出試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものではない。

1. 薬剤

- ・試験製剤 : ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」
- ・標準製剤 : ビラノア OD 錠 20mg

2. 試験方法

日局 一般試験法 溶出試験法(パドル法)

3. 試験条件

- ・試験液量 : 900mL
- ・試験液温 : 37±0.5℃

- ・試験液：水
pH1.2=溶出試験第1液
pH5.0=pH5.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液
pH6.8=溶出試験第2液
- ・回転数：50rpm
(50rpmですべての試験において、30分以内に試験製剤、標準製剤ともに平均85%以上溶出したため100rpmでの試験は実施しなかった。)
- ・試験回数：各12ベッセル

4. 試験時間

- ・5、10及び15分

5. 分析法

液体クロマトグラフィー

6. 結果

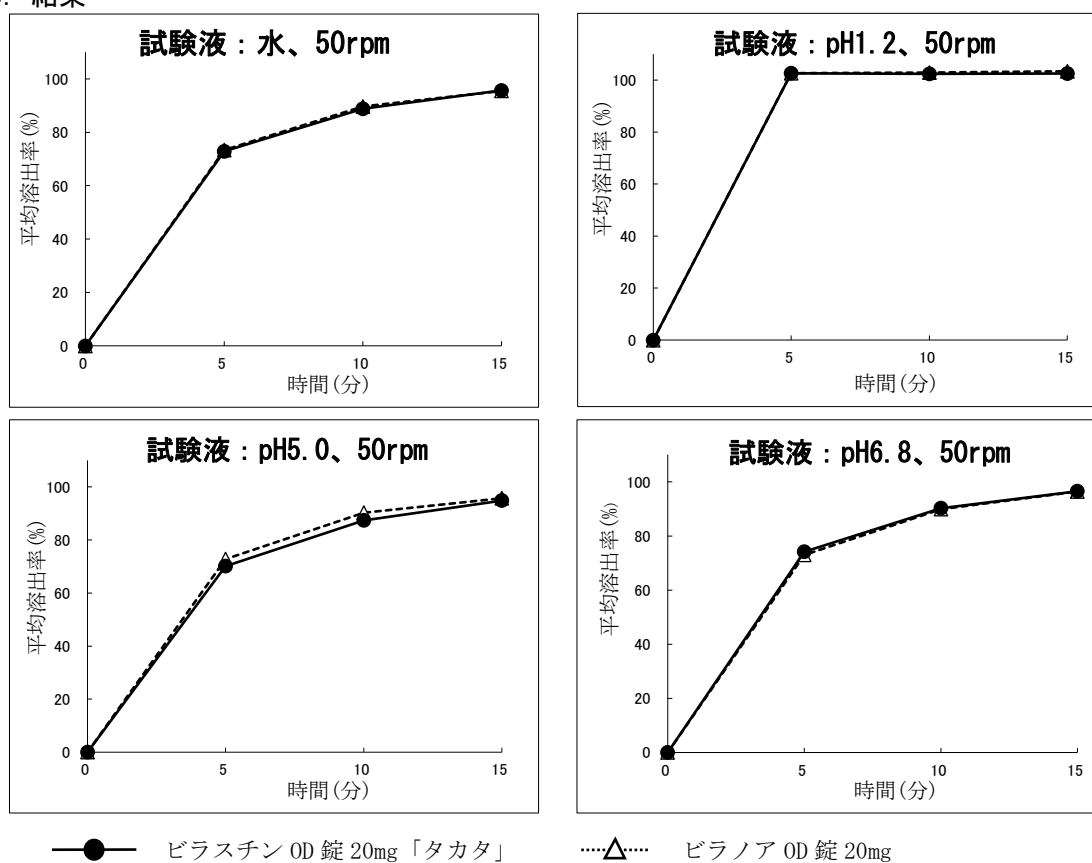


図 ビラスチン OD錠 20mg「タカタ」とビラノア OD錠 20mgの平均溶出曲線

表 溶出挙動の類似性の判定結果

試験条件		判定基準		平均溶出率 (%)		判定
回転数	試験液	溶出率	判定時間(分)	標準製剤	試験製剤	
50rpm	水	15分以内に 平均85%以上 溶出	15	95.5	95.7	適
	pH1.2		15	103.4	102.5	適
	pH5.0		15	95.7	94.8	適
	pH6.8		15	96.4	96.5	適

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装, 外観が特殊な容器・包装に関する情報
該当しない

(2) 包装

PTP 包装: 100錠 [10錠(PTP) × 10]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP 包装	PTP: ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔 個装箱: 紙
--------	------------------------------------

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- | |
|---|
| 4. 効能又は効果
○ アレルギー性鼻炎
○ 蕁麻疹
○ 皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒 |
|---|

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

- | |
|--|
| 6. 用法及び用量
通常、成人にはビラスチンとして1回20mgを1日1回空腹時に経口投与する。 |
|--|

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

- | |
|---|
| 17. 臨床成績
17.1 有効性及び安全性に関する試験
〈アレルギー性鼻炎〉
17.1.1 国内第Ⅲ相試験
通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした二重盲検比較試験において、ビラスチン錠 |
|---|

20mg(1日1回)、フェキソフェナジン塩酸塩 120mg(1回60mg1日2回)又はプラセボを2週間経口投与した。主要評価項目である「総合鼻症状スコア(鼻汁、くしゃみ発作、鼻閉、鼻内そう痒感)の期間平均変化量^{a)}」は、ビラスチン錠 20mg1日1回投与によりプラセボに対して有意な減少を示した^{3,4)}。

表 17-1 通年性アレルギー性鼻炎を対象とした比較試験成績

投与群	症例数	ベースライン ^{b)}	Day 10~13	変化量 ^{a)}	プラセボとの差 ^{c)}
ビラスチン錠 20mg 群	249	7.48±1.54	6.48±2.12	-1.00±1.83	-0.35 [-0.65 ~-0.05] p 値 : 0.023
フェキソフェナジン群	247	7.38±1.43	6.42±1.97	-0.96±1.87	-0.34 [-0.64 ~-0.04]
プラセボ群	251	7.33±1.49	6.73±1.87	-0.60±1.72	

解析対象 : FAS、平均値±標準偏差、[] : 95%信頼区間、欠測値の補完なし

a : ベースラインに対する投与 Day 10~13 の平均スコアの変化量

b : 投与前4日間の平均スコア

c : 投与群、ベースライン及び施設を説明変数とした線形モデル

(ただし、20mg 群の解析ではフェキソフェナジン群のデータは用いていない)

ビラスチン錠 20mg 投与群の副作用発現率は 2.0% (5/255 例)であった。その内訳は傾眠 0.8% (2/255 例)、下痢、鼻乾燥及び円形脱毛症が各 0.4%(1/255 例)であった。

〈蕁麻疹〉

17.1.2 国内第Ⅱ/Ⅲ相試験

国内試験において、慢性蕁麻疹患者を対象とした二重盲検比較試験において、ビラスチン錠 20mg(1日1回)、ビラスチン錠 10mg(1日1回)^{注)}、又はプラセボを2週間経口投与した。主要評価項目である「総合症状スコア(発斑、かゆみ)の期間平均変化量^{a)}」は、ビラスチン錠 20mg1日1回投与によりプラセボに対して有意な減少を示した^{5,6)}。

表 17-2 慢性蕁麻疹を対象とした比較試験成績

投与群	症例数	ベースライン ^{b)}	Day 8~14	変化量 ^{a)}	プラセボとの差 ^{c)}
ビラスチン錠 20mg 群	100	4.54±0.89	1.52±1.36	-3.02±1.63	-1.52 [-1.89 ~-1.15]
プラセボ群	95	4.49±0.95	3.02±1.32	-1.47±1.24	p 値 : < 0.001

解析対象：FAS、平均値±標準偏差、[]：95%信頼区間、欠測値の補完なし

a：ベースラインに対する投与 Day 8～14 の平均スコアの変化量

b：投与前4日間の平均スコア

c：投与群、ベースラインを説明変数とした線形モデル

ビラスチン錠 20mg 投与群の副作用発現率は2.0% (2/101例)であった。その内訳は血中ビリルビン増加及び頭痛が各1.0% (1/101例)であった。

2) 安全性試験

16.3.2 脳内への移行

健康成人(12例)を対象に、ビラスチン錠 20mg、ヒドロキシジン及びプラセボを二重盲検、クロスオーバーでそれぞれ単回投与し、脳への移行性を検討した結果、ビラスチンによる大脳皮質のヒスタミン H₁ 受容体の占拠は認めなかった⁷⁾(外国人データ)。^[17.3.1 参照]

〈皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒〉

17.1.3 国内第Ⅲ相試験

皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒患者を対象に実施した非盲検長期投与試験(52週間投与)において、ビラスチン錠 20mg 1日1回投与した結果(116例)、かゆみスコアは投与早期からベースラインに比べて減少し、52週まで持続した⁸⁾。

副作用発現率は2.5% (5/197例)であった。その内訳は傾眠1.0% (2/197例)、AST増加、 γ -GTP増加及び夜間頻尿が各0.5% (1/197例)であった。

17.3 その他

17.3.1 精神運動能に及ぼす影響

(1) 健康成人(18例)を対象に、ビラスチン錠 20mg、ビラスチン錠 40mg^{注)}、ヒドロキシジン及びプラセボを二重盲検、クロスオーバーでそれぞれ1日1回8日間反復投与し、ドライビング試験により自動車運転能に及ぼす影響を評価したとき、ビラスチン錠の自動車運転能に及ぼす影響はプラセボと有意な差を認めなかった⁹⁾(外国人データ)。^[16.3.2 参照]

(2) 健康成人(20例)を対象に、ビラスチン錠 20mg、ビラスチン錠 40mg、ビラスチン錠 80mg^{注)}、ヒドロキシジン及びプラセボを二重盲検、クロスオーバーでそれぞれ1日1回7日間反復投与し、中枢神経系に及ぼす影響を評価した。客観的評価ではビラスチン錠 20mg 及び 40mg はプラセボとの間に差は認められなかったが、主観的評価ではビラスチン錠 40mg 及び 80mg ではプラセボと比較して、影響が認められた¹⁰⁾(外国人データ)。^[16.3.2 参照]

17.3.2 心血管系へ及ぼす影響

健康成人(30例)を対象に、ビラスチン錠 20mg、ビラスチン錠 100mg^{注)}、ビラスチン錠 20mg+ケトコナゾール 400mg、モキシフロキサシン 400mg 及びプラセボを二重盲検、クロスオーバーでそれぞれ1日1回4日間反復投与し(モキシフロキサシンのみ3日間)、

心室再分極に及ぼす影響を評価した。主要評価項目を「QTcNi^aのベースラインからの変化量のプラセボとの差」として評価した結果、ピラスチン錠 20mg 及び 100mg では、投与後のいずれの時点でもプラセボに対する QTcNi のベースラインからの変化量の片側 95% 信頼区間の上限は 10msec を上回らなかった¹⁾ (外国人データ)。

a : 線形補正し個別の被験者データを用いて補正した QT 間隔

注) 本剤の承認用量は 1 回 20mg、1 日 1 回である。

(5) 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(一般使用成績調査, 特定使用成績調査, 使用成績比較調査), 製造販売後データベース調査, 製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

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

ケミカルメディエータ受容体拮抗作用 (ルパタジンフマル酸塩、デスロラタジン、オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩)¹²⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ビラスチンはヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用及び抗アレルギー作用を示す。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用

受容体結合試験において、ヒトのヒスタミン H₁ 受容体に拮抗作用 (K_i 値 : 64nmol/L) を示した (*in vitro*)。モルモット摘出回腸標本及び気管標本において、ヒスタミン誘発収縮をそれぞれ 100nmol/L と 30nmol/L より抑制した (*in vitro*)。経口投与による動物試験においては、ラット及びモルモットのヒスタミン誘発血管透過性亢進を抑制した。静脈内投与による動物試験においては、麻酔下モルモットのヒスタミン誘発気道収縮を抑制した^{13~15)}。

18.3 抗アレルギー作用

抗原感作したモルモットの摘出回腸標本において、抗原誘発収縮を抑制した (IC₅₀ 値 : 95.5nmol/L)^{13, 14)} (*in vitro*)。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回及び反復投与

健康成人男性 20 例にビラスチン錠 20mg を空腹時単回経口投与したとき、血漿中濃度は速やかに上昇し、投与後 1.00 時間で最高血漿中濃度 277.86ng/mL に到達した後、消失半減期 10.54 時間で消失した¹⁶⁾。

ビラスチンの薬物動態は 10mg、20mg 及び 50mg の用量^{注1)}で線形性を示した。反復投与による蓄積はなかった¹⁷⁾。

注 1) 本剤の承認用量は 1 回 20mg、1 日 1 回である。

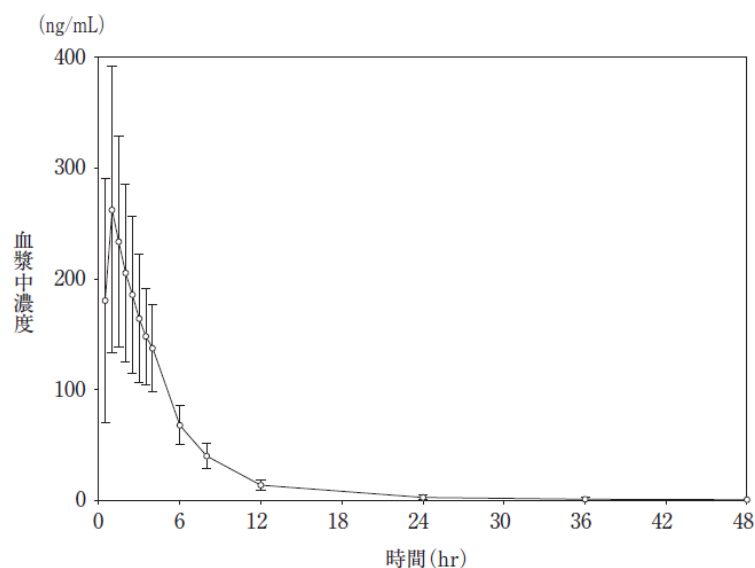


図 16-1 ビラスチン錠 20mg 単回経口投与時のビラスチン血漿中濃度
空腹時投与、平均値±標準偏差(20 例)

表 16-1 ビラスチン錠 20mg 単回経口投与時の薬物速度論的パラメータ

投与量 (mg)	C_{max} (ng/mL)	t_{max} (hr)	AUC_{0-inf} (ng · hr/mL)	$t_{1/2}$ (hr)
20	277.86 (117.40)	1.0 (0.5-2.5)	1296.45 ^a (368.26)	10.54 ^a (5.50)

空腹時投与、平均値(標準偏差)20 例 [a : 19 例]、 t_{max} は中央値(最小値-最大値)

16.1.2 生物学的同等性試験

<水なしで服用>

ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」とビラノア OD 錠 20mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠(ビラスチンとして 20mg)、健康成人男性 44 例に絶食時に水なしで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_{max}) につい

て90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁸⁾。

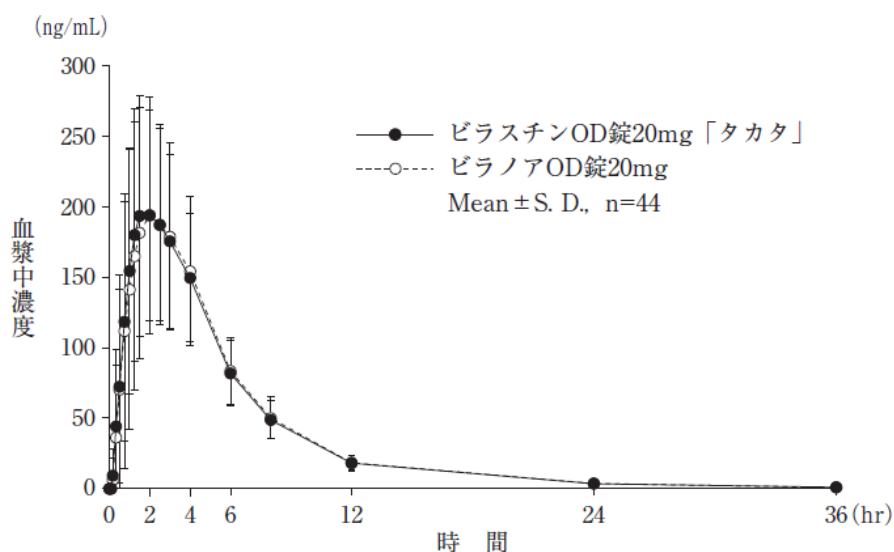


図 16-2 血漿中濃度(水なしで服用)

表 16-2 薬物動態パラメータ(水なしで服用)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ビラスチン OD錠20mg 「タカタ」	1261.06 ± 324.39	225.58 ± 79.76	1.99 ± 0.91	5.60 ± 1.33
ビラノア OD錠20mg	1266.55 ± 349.12	229.66 ± 83.77	1.88 ± 0.85	5.32 ± 1.13

(Mean ± S. D., n=44)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}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。

<水で服用>

ビラスチン OD錠 20mg 「タカタ」とビラノア OD錠 20mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(ビラスチンとして20mg)、健康成人男性47例に絶食時に水で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_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁸⁾。

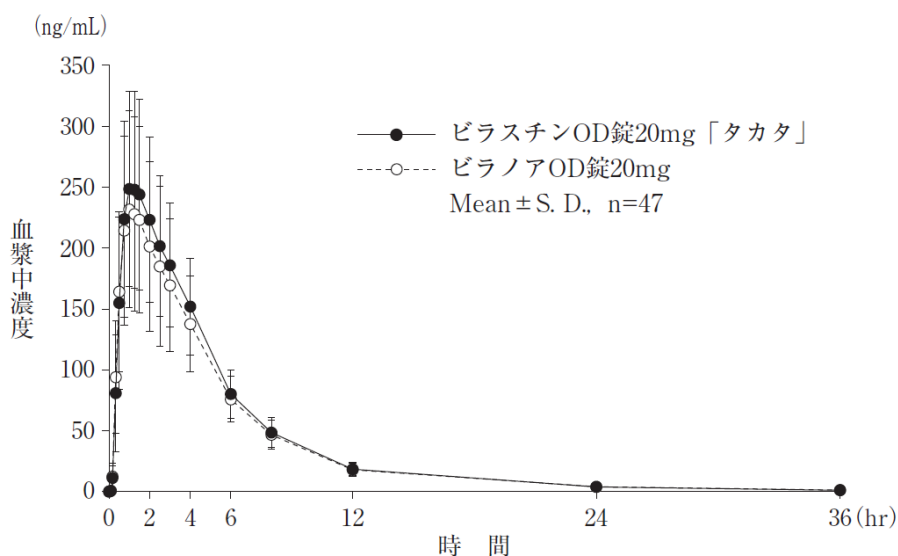


図 16-3 血漿中濃度(水で服用)

表 16-3 薬物動態パラメータ(水で服用)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」	1406.91 ± 298.98	271.66 ± 75.94	1.29 ± 0.58	5.87 ± 1.15
ビラノア OD 錠 20mg	1321.70 ± 303.69	248.32 ± 78.05	1.32 ± 0.75	6.06 ± 1.41

(Mean ± S. D., n=47)

血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

16. 薬物動態

16.2 吸収

16.2.1 食事の影響

健康成人男性 20 例にクロスオーバー法で空腹時及び食後(高脂肪食)にビラスチン錠 20mg を単回経口投与したとき空腹時に比べ食後投与時の C_{max} 及び AUC_{0-t} はそれぞれ約 60%及び約 40%低下した¹⁶⁾。

16.7.1 エリスロマイシン

健康成人 24 例にビラスチン錠 20mg1 日 1 回とエリスロマイシン 500mg1 日 3 回 7 日間併用反復経口投与したとき、血漿中ビラスチンの C_{max} 及び AUC₀₋₂₄ はそれぞれ約 2.9 倍及び約 1.9 倍に上昇した¹⁹⁾(外国人データ)。[10.2 参照]

16.7.2 ケトコナゾール

健康成人 24 例にビラスチン錠 20mg1 日 1 回とケトコナゾール^{注2)}400mg1 日 1 回 6 日間併

用反復経口投与したとき、血漿中ビラスチンの C_{max} 及び AUC_{0-24} はそれぞれ約 2.6 倍及び約 2 倍に上昇した²⁰⁾ (外国人データ)。

16.7.3 ジルチアゼム

健康成人 12 例 (PK 解析 11 例) にビラスチン錠 20mg とジルチアゼム 60mg 併用単回経口投与したとき、血漿中ビラスチンの C_{max} 及び AUC_{0-inf} はそれぞれ約 1.5 倍及び約 1.3 倍に上昇した²¹⁾ (外国人データ)。[10.2 参照]

16.7.4 グレープフルーツジュース

健康成人 12 例にビラスチン錠 20mg をグレープフルーツジュース 240mL で投与したとき、血漿中ビラスチンの C_{max} 及び AUC_{0-inf} はそれぞれ約 0.6 倍及び約 0.7 倍に低下した。この血漿中ビラスチン濃度の低下はグレープフルーツジュースによるビラスチンの消化管からの吸収阻害に起因すると推察されたが機序は不明である²²⁾ (外国人データ)。

注 2) 経口剤は国内未承認。

「Ⅷ. 7. (2) 併用注意とその理由」の項参照

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) 消失速度定数¹⁸⁾

		消失速度定数 [ke1 (hr ⁻¹)]
ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」	水なしで服用	0.1308 ± 0.0310 (n=44)
	水で服用	0.1299 ± 0.0255 (n=47)

Mean ± S. D.

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団 (ポピュレーション) 解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 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. 6. (5) 妊婦」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 6. (6) 授乳婦」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

(6) 血漿蛋白結合率

16.3 分布

16.3.1 蛋白結合率

ビラスチンの *in vitro* ヒト血漿蛋白結合率は 0.2~1 μ g/mL の濃度範囲において、84.22~90.04%であった²³⁾。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

健康成人男性 6 例に ¹⁴C-ビラスチン 20mg を単回経口投与したとき、ビラスチンはほとんど代謝されなかった^{24,25)} (外国人データ)。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種, 寄与率

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活性比, 存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人男性 9 例にビラスチン錠 20mg を空腹時単回経口投与したとき、投与後 72 時間までの尿中ビラスチンの平均累積排泄率は 47.3%であった¹⁷⁾。

健康成人男性 6 例に¹⁴C-ビラスチン 20mg を単回経口投与したとき、放射能は投与後 7 日までに尿中に 33.1%、糞中に 67.0%が排泄された。ビラスチンは、尿中に 28.31%、糞中に 66.53%が未変化体で排泄された^{24, 25)} (外国人データ)。[9.8 参照]

8. トランスポーターに関する情報

16.7 薬物相互作用

ビラスチンは有機アニオン輸送ポリペプチド OATP1A2 の基質である²⁶⁾。

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

成人の腎機能障害患者にビラスチン錠 20mg を単回経口投与したとき、重度の腎機能障害患者におけるビラスチンの C_{max} 及び AUC_{0-inf} は健康成人に比べそれぞれ 1.6 倍及び 2.3 倍高かった²⁷⁾ (外国人データ)。[9.2.1 参照]

表 16-4 腎機能障害患者にビラスチン錠 20mg 単回経口投与時の薬物速度論的パラメータ

腎機能 [GFR (mL/min/1.73m ²)]	C_{max} (ng/mL)	t_{max} (hr)	AUC_{0-inf} (ng · hr/mL)	$t_{1/2}$ (hr)
正常 (GFR > 80)	144.0 (57.8)	1.5 (1.0-3.0)	737.4 (260.8)	9.26 (2.79)
軽度低下 (50 ≤ GFR ≤ 80)	172.1 (45.0)	1.5 (0.5-3.0)	967.4 (140.2)	15.08 (7.66)
中等度低下 (30 ≤ GFR < 50)	271.1 (30.4)	2.25 (1.0-2.5)	1384.2 (263.2)	10.47 (2.34)
重度低下 (GFR < 30)	228.8 (81.8)	1.5 (0.5-3.0)	1708.5 (699.0)	18.39 (11.40)

各 6 例の平均値 (標準偏差)、 t_{max} は中央値 (最小値-最大値)

16.6.2 高齢者

若齢男性及び女性 (18~35 歳)、高齢男性及び女性 (65 歳以上) の 4 グループ (各 8 例、計 32 例) にビラスチン錠 20mg を単回経口投与したとき、若齢男性と高齢男性ではビラスチンの C_{max} 及び AUC_{0-inf} に差はなかった。若齢女性と高齢女性ではビラスチンの C_{max} は若齢女性が 1.7 倍高かったが、 AUC_{0-inf} に差はなかった²⁸⁾ (外国人データ)。

「VIII. 6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照

11. その他

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

〈アレルギー性鼻炎〉

8.2 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 中等度($30 \leq \text{GFR} < 50 \text{ mL/min/1.73m}^2$)又は重度($\text{GFR} < 30 \text{ mL/min/1.73m}^2$)の腎機能障害のある患者

本剤の血漿中濃度が上昇するおそれがある。[16.6.1 参照]

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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る場合にのみ投与すること。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

授乳中の女性には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。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。

(7) 小児等

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。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

一般的に生理機能が低下していることが多く、腎臓からも排泄される本剤では血中濃度が上昇するおそれがある。[16.5 参照]

7. 相互作用

10. 相互作用

ピラスチンはP糖蛋白の基質である²⁶⁾。

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 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
エリスロマイシン ジルチアゼム [16.7.1、16.7.3 参照]	本剤の血漿中濃度を上昇させるとの報告がある。	P糖蛋白の阻害による本剤の吸収率の増加に起因すると推定される。

8. 副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用		
	1%未満	頻度不明
精神神経系	眠気、頭痛	めまい、不眠、不安
消化器	口渇、下痢、腹痛	胃不快感、口内乾燥、消化不良、胃炎、悪心
循環器		右脚ブロック、洞性不整脈、心電図QT延長、心電図異常、頻脈、動悸
肝臓	AST上昇、 γ -GTP上昇	ALT上昇
腎臓		血中クレアチニン上昇
呼吸器	鼻乾燥	呼吸困難、鼻部不快感
過敏症		発疹、そう痒症、血管性浮腫、多形紅斑
その他		耳鳴、発熱、体重増加、トリグリセリド上昇、無力症、口腔ヘルペス、食欲亢進、疲労

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルギー皮内反応を抑制するため、アレルギー皮内反応検査を実施する3～5日前より本剤の投与を中止することが望ましい。

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 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ある。

14.1.2 本剤は舌の上のにせ唾液を浸潤させ、崩壊後唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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：劇薬

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

該当資料なし

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：ピラノア錠 20mg/OD 錠 20mg

7. 国際誕生年月日

2010年9月8日(ドイツ)

8. 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日

履歴	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
-	2026年2月16日	30800AMX00023	2026年6月12日	2026年6月12日

9. 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

10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価 基準収載医薬品 コード	個別薬品コード (YJ コード)	HOT(9桁)番号	レセプト電算 処理システム用 コード
ピラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」	4490033F2091	4490033F2091	130112002	623011201

14. 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) 社内資料：安定性試験(ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」)
- 2) 社内資料：溶出性試験(ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」)
- 3) Okubo K, et al. : Allergol Int. 2017 ; 66(1) : 97-105
- 4) 通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした臨床第Ⅲ相試験(ビラノア錠 : 2016 年 9 月 28 日承認、申請資料概要 2.7.6.24)
- 5) Hide M, et al. : Allergol Int. 2017 ; 66(2) : 317-325
- 6) 慢性蕁麻疹患者を対象とした臨床第Ⅱ/Ⅲ相試験(ビラノア錠 : 2016 年 9 月 28 日承認 申請資料概要 2.7.6.33)
- 7) Farré M, et al. : Br J Clin Pharmacol. 2014 ; 78(5) : 970-980
- 8) Yagami A, et al. : J Dermatol. 2017 ; 44(4) : 375-385
- 9) Conen S, et al. : J Psychopharmacol. 2011 ; 25(11) : 1517-1523
- 10) García-Gea C, et al. : J Clin Psychopharmacol. 2008 ; 28(6) : 675-685
- 11) Tyl B, et al. : J Clin Pharmacol. 2012 ; 52(6) : 893-903
- 12) 薬剤分類情報閲覧システム<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yaku_zaiMenu/> (2026 年 1 月 9 日アクセス)
- 13) Corcóstegui R, et al. : Drugs R D. 2005 ; 6(6) : 371-384
- 14) Corcóstegui R, et al. : Drugs R D. 2006 ; 7(4) : 219-231
- 15) ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用(ビラノア錠 : 2016 年 9 月 28 日承認、申請資料概要 2.6.2.2)
- 16) 「食事の影響に関する臨床薬理試験」における薬物動態解析(ビラノア錠 : 2016 年 9 月 28 日承認、申請資料概要 2.7.1.2、2.7.6.1)
- 17) 「健康成人男性を対象とした臨床第Ⅰ相単回及び反復投与試験」における薬物動態の検討(ビラノア錠 : 2016 年 9 月 28 日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.5)
- 18) 社内資料：生物学的同等性試験(ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」)
- 19) A pharmacokinetic and safety study evaluating the potential interaction of erythromycin and bilastine under steady-state conditions in healthy volunteers(ビラノア錠 : 2016 年 9 月 28 日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.12)
- 20) A pharmacokinetic and safety study evaluating the potential interaction of ketoconazole and bilastine under steady-state conditions in healthy volunteers(ビラノア錠 : 2016 年 9 月 28 日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.13)
- 21) A phase 1, open-label, randomised, two-way crossover study to evaluate the effect of diltiazem on the single-dose pharmacokinetics of bilastine in healthy adult subjects(ビラノア錠:2016 年 9 月 28 日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.14)
- 22) A phase 1, open-label, randomised, two-way crossover study to evaluate the

- effect of grapefruit juice on the single-dose pharmacokinetics of bilastine in healthy adult subjects(ビラノア錠：2016年9月28日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.15)
- 23) 血漿蛋白結合(ビラノア錠：2016年9月28日承認、申請資料概要 2.6.4.4)
 - 24) A phase I study to investigate the absorption,metabolism and excretion of [¹⁴C] -bilastine following oral administration to healthy volunteers(ビラノア錠：2016年9月28日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.7)
 - 25) ¹⁴C 標識体単回経口投与後のヒトマスバランスの検討(ビラノア錠：2016年9月28日承認、申請資料概要 2.7.2.2)
 - 26) ヒト OATP1B1、OATP1B3、OATP1A2、OATP2B1 又は OCT1 の基質としての検討(ビラノア錠：2016年9月28日承認、申請資料概要 2.7.2.2)
 - 27) Evaluation of the single-dose pharmacokinetics of bilastine in subjects with various degrees of renal insufficiency(ビラノア錠：2016年9月28日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.11)
 - 28) An open-label study to assess the effects of age and gender on the pharmacokinetic profile and pharmacodynamics of bilastine in healthy volunteers(ビラノア錠：2016年9月28日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.10)
 - 29) 社内資料：粉碎後の安定性試験(ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」)
 - 30) 社内資料：崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性試験(ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

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

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) 粉碎²⁹⁾

「25℃、75%RH、遮光、開放」で3箇月の保存条件では、含量は規格内であり、外観は変化がなかったが、1箇月、2箇月及び3箇月で水分の僅かな増加が認められ、残存率に変化があった。

「25℃、成り行き湿度、3000 lx、気密」で120万lx・hrの保存条件では、含量は規格内だが低下が認められ、外観は変化がなかったが、60万lx・hr及び120万lx・hrの保存条件では水分、残存率に変化があった。

表1

(1ロット)

保存条件	試験項目	試験開始時	1箇月	2箇月	3箇月
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	白色の粉末	白色の粉末		
	含量(%)	98.93	98.49	98.12	98.40
	残存率(%)	100.0	99.6	99.2	99.5
	水分(%)	1.16	1.56	1.45	1.51

《参考》

- ・ 製剤の規格値を用いて判定した項目: 含量
- ・ 規格値を設定していない項目: 外観、水分、残存率

表2

(1ロット)

保存条件	試験項目	試験開始時	60万lx・hr	120万lx・hr
25℃ 成り行き湿度※ 3000 lx / 気密	外観	白色の粉末	白色の粉末	
	含量(%)	98.93	95.26	96.77
	残存率(%)	100.0	96.3	97.8
	水分(%)	1.16	1.06	1.14

※保存時の成り行き湿度:15.6~27.1%RH(平均:16.4%RH)

《参考》

- ・ 製剤の規格値を用いて判定した項目: 含量
- ・ 規格値を設定していない項目: 外観、水分、残存率

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性³⁰⁾

1. 試験方法

(1) 崩壊懸濁試験

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に錠剤 1 錠をそのまま入れてピストンを戻しディスペンサーに 55℃の温湯 20mL を吸い取り、筒先の蓋をして 5 分間自然放置後、崩壊・懸濁の状況を観察した。崩壊・懸濁しない場合、さらに追加 5 分間自然放置後、崩壊・懸濁の状況を観察した。

5 分間または追加 5 分間(計 10 分間の自然放置)の自然放置で崩壊・懸濁が確認できた場合は、確認できた時点でディスペンサーを手で 180 度 15 往復横転して攪拌し崩壊・懸濁の状況を観察した。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、この方法を中止することとした。

(2) チューブ通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液の入ったディスペンサーを経管栄養チューブに接続し、約 2~3mL/秒(10 秒で 20mL)の速度で注入した。チューブは、ベッド上の患者様を想定し、体内挿入端から 3 分の 2 を水平にし、他端(注入端)をチューブ長に合わせ 10~30cm の高さにセットした。サイズは 4Fr. (フレンチ)を用いて通過性を観察した。4Fr. のチューブ通過性に問題がある場合、チューブのサイズを 6、8、12、14、16Fr. の順に替えて注入し、通過性を観察した。実施後、ディスペンサー内の状況を観察した。懸濁液を注入した後に適量の水を同じディスペンサーで吸い取り、チューブ内を洗う(フラッシュする)時、ディスペンサー内・チューブ内に薬剤が残存していなければ通過性に問題なしとした。

なお、従来のチューブのサイズは 8Fr. からの開始であるが小児向けを想定し、4Fr. からの開始とした。

2. 試験製剤

ビラスチン OD 錠 20mg 「タカタ」(1 錠)

3. 試験時期

2025 年 10 月 31 日

4. 試験結果

(1) 崩壊懸濁試験

5 分以内に崩壊・懸濁した。

(2) チューブ通過性試験

4Fr. のチューブを通過した。

2. その他の関連資料

日本ジェネリック株式会社 医療関係者向けサイト

<https://medical.nihon-generic.co.jp/>