

# 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

ビラスチン錠

**ビラスチン錠20mg「明治」**

ビラスチン口腔内崩壊錠

**ビラスチンOD錠20mg「明治」**

**BILASTINE Tablets, OD Tablets「MEIJI」**

剤形	ビラスチン錠20mg「明治」：錠剤（素錠） ビラスチンOD錠20mg「明治」：錠剤（素錠、口腔内崩壊錠）
製剤の規制区分	処方箋医薬品 <sup>注）</sup> 注）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：薬価基準未収載 販売開始年月日：
製造販売（輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元： <b>Meiji Seika ファルマ株式会社</b>
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	Meiji Seikaファルマ株式会社 くすり相談室 TEL (0120) 093-396、(03) 3273-3539 FAX (03) 3272-2438 受付時間：9時～17時 （土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.meiji-seika-pharma.co.jp/medical/">https://www.meiji-seika-pharma.co.jp/medical/</a>

本 IF は 2026 年 2 月作成（第 1 版）の電子添文の記載に基づき作成した。  
最新の情報は、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。

# 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	6. 製剤の各種条件下における安定性	5
1. 開発の経緯	1	7. 調製法及び溶解後の安定性	5
2. 製品の治療学的特性	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	5
3. 製品の製剤学的特性	1	9. 溶出性	5
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	10. 容器・包装	9
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(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	9
(1) 承認条件	1	(2) 包装	9
(2) 流通・使用上の制限事項	1	(3) 予備容量	9
6. RMP の概要	1	(4) 容器の材質	9
II. 名称に関する項目	2	11. 別途提供される資材類	9
1. 販売名	2	12. その他	9
(1) 和名	2	V. 治療に関する項目	10
(2) 洋名	2	1. 効能又は効果	10
(3) 名称の由来	2	2. 効能又は効果に関連する注意	10
2. 一般名	2	3. 用法及び用量	10
(1) 和名（命名法）	2	(1) 用法及び用量の解説	10
(2) 洋名（命名法）	2	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	10
(3) ステム（stem）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	10
3. 構造式又は示性式	2	5. 臨床成績	10
4. 分子式及び分子量	2	(1) 臨床データパッケージ	10
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(2) 臨床薬理試験	10
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(3) 用量反応探索試験	10
III. 有効成分に関する項目	3	(4) 検証的試験	10
1. 物理化学的性質	3	(5) 患者・病態別試験	12
(1) 外観・性状	3	(6) 治療的使用	12
(2) 溶解性	3	(7) その他	12
(3) 吸湿性	3	VI. 薬効薬理に関する項目	13
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	13
(5) 酸塩基解離定数	3	2. 薬理作用	13
(6) 分配係数	3	(1) 作用部位・作用機序	13
(7) その他の主な示性値	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	13
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(3) 作用発現時間・持続時間	13
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	VII. 薬物動態に関する項目	14
IV. 製剤に関する項目	4	1. 血中濃度の推移	14
1. 剤形	4	(1) 治療上有効な血中濃度	14
(1) 剤形の区別	4	(2) 臨床試験で確認された血中濃度	14
(2) 製剤の外観及び性状	4	(3) 中毒域	17
(3) 識別コード	4	(4) 食事・併用薬の影響	17
(4) 製剤の物性	4	2. 薬物速度論的パラメータ	17
(5) その他	4	(1) 解析方法	17
2. 製剤の組成	4	(2) 吸収速度定数	17
(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添 加剤	4	(3) 消失速度定数	18
(2) 電解質等の濃度	5	(4) クリアランス	18
(3) 熱量	5	(5) 分布容積	18
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	(6) その他	18
4. 力価	5	3. 母集団（ポピュレーション）解析	18
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	(1) 解析方法	18
		(2) パラメータ変動要因	18

4. 吸収 .....	18	2. 毒性試験.....	24
5. 分布 .....	18	(1) 単回投与毒性試験.....	24
(1) 血液－脳関門通過性 .....	18	(2) 反復投与毒性試験.....	24
(2) 血液－胎盤関門通過性 .....	18	(3) 遺伝毒性試験.....	24
(3) 乳汁への移行性 .....	18	(4) がん原性試験.....	24
(4) 髄液への移行性 .....	18	(5) 生殖発生毒性試験.....	24
(5) その他の組織への移行性 .....	18	(6) 局所刺激性試験.....	24
(6) 血漿蛋白結合率 .....	19	(7) その他の特殊毒性.....	24
6. 代謝 .....	19	<b>X. 管理的事項に関する項目.....</b>	<b>25</b>
(1) 代謝部位及び代謝経路 .....	19	1. 規制区分.....	25
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分		2. 有効期間.....	25
子種、寄与率 .....	19	3. 包装状態での貯法.....	25
(3) 初回通過効果の有無及びその割合.....	19	4. 取扱い上の注意.....	25
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存		5. 患者向け資材.....	25
在比率 .....	19	6. 同一成分・同効薬.....	25
7. 排泄 .....	19	7. 国際誕生年月日.....	25
8. トランスポーターに関する情報.....	19	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基	
9. 透析等による除去率 .....	19	準収載年月日、販売開始年月日.....	25
10. 特定の背景を有する患者 .....	19	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加	
11. その他 .....	20	等の年月日及びその内容.....	25
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目... 21</b>		10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びそ	
1. 警告内容とその理由 .....	21	の内容.....	25
2. 禁忌内容とその理由 .....	21	11. 再審査期間.....	25
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由.....	21	12. 投薬期間制限に関する情報.....	25
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由.....	21	13. 各種コード.....	26
5. 重要な基本的注意とその理由.....	21	14. 保険給付上の注意.....	26
6. 特定の背景を有する患者に関する注意... 21		<b>XI. 文献.....</b>	<b>27</b>
(1) 合併症・既往歴等のある患者.....	21	1. 引用文献.....	27
(2) 腎機能障害患者 .....	21	2. その他の参考文献.....	28
(3) 肝機能障害患者 .....	21	<b>XII. 参考資料.....</b>	<b>29</b>
(4) 生殖能を有する者 .....	21	1. 主な外国での発売状況.....	29
(5) 妊婦 .....	21	2. 海外における臨床支援情報.....	29
(6) 授乳婦 .....	22	<b>XIII. 備考 .....</b>	<b>31</b>
(7) 小児等 .....	22	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うに	
(8) 高齢者 .....	22	あたつての参考情報.....	31
7. 相互作用 .....	22	(1) 粉碎.....	31
(1) 併用禁忌とその理由 .....	22	(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ	
(2) 併用注意とその理由 .....	22	の通過性.....	31
8. 副作用 .....	22	2. その他の関連資料.....	31
(1) 重大な副作用と初期症状 .....	22		
(2) その他の副作用 .....	23		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	23		
10. 過量投与 .....	23		
11. 適用上の注意 .....	23		
12. その他の注意 .....	23		
(1) 臨床使用に基づく情報 .....	23		
(2) 非臨床試験に基づく情報 .....	23		
<b>IX. 非臨床試験に関する項目 .....</b>	<b>24</b>		
1. 薬理試験 .....	24		
(1) 薬効薬理試験 .....	24		
(2) 安全性薬理試験 .....	24		
(3) その他の薬理試験 .....	24		

## 略語表

略語	略語内容
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	血漿中濃度－時間曲線下面積
C <sub>max</sub>	最高血漿中濃度
CYP	チトクロム P-450
GFR	糸球体濾過量
RMP	医薬品リスク管理計画
T <sub>1/2</sub> 、t <sub>1/2</sub>	消失半減期
T <sub>max</sub> 、t <sub>max</sub>	最高血漿中濃度到達時間
γ-GTP	γ-グルタミルトランスペプチダーゼ

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ビラスチンはヒスタミン  $H_1$  受容体拮抗作用及び抗アレルギー作用を示すアレルギー性疾患治療剤である。

ビラスチン錠 20mg「明治」及びビラスチン OD 錠 20mg「明治」は Meiji Seika ファルマ株式会社が後発医薬品として申請し、2026 年 2 月に製造販売承認を取得した。

### 2. 製品の治療学的特性

(1) 1 日 1 回投与で、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患に伴うそう痒に対して、効果を発現し、その効果は持続する。（「V. 1. 効能又は効果」、「V. 3. 用法及び用量」の項参照）

(2) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーがあらわれることがある。（「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

(1) ビラスチン OD 錠 20mg「明治」は水なしでも服用可能な口腔内崩壊錠である。（「IV. 1. 剤形」の項参照）

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、 最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2026年2月現在)

### 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

該当しない

### 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

ビラスチン錠 20mg 「明治」  
ビラスチン OD 錠 20mg 「明治」

#### (2) 洋名

Bilastine Tablets 「MEIJI」  
Bilastine OD Tablets 「MEIJI」

#### (3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格(含量)＋「明治」  
OD 錠：Orally Disintegrating Tablets

### 2．一般名

#### (1) 和名（命名法）

ビラスチン（JAN）

#### (2) 洋名（命名法）

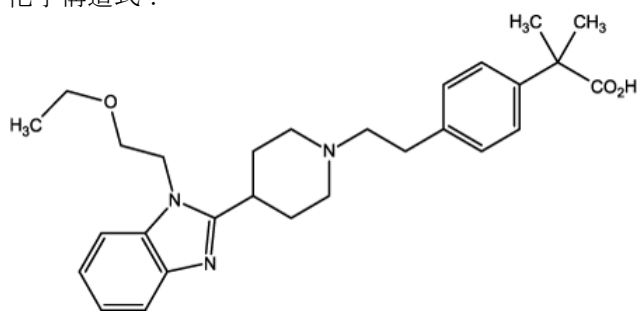
Bilastine（JAN、INN）

#### (3) ステム（stem）

-astine (x) : antihistaminics <sup>1)</sup>

### 3．構造式又は示性式

化学構造式：



### 4．分子式及び分子量

分子式：C<sub>28</sub>H<sub>37</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>

分子量：463.61

### 5．化学名（命名法）又は本質

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

### 6．慣用名、別名、略号、記号番号



### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

ビラスチンは白色の粉末である。

(2) 溶解性

該当資料なし

(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：紫外可視吸収測定法、赤外吸収スペクトル法（臭化カリウム錠剤法）

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

ビラスチン錠 20mg「明治」 : 錠剤（素錠）  
 ビラスチン OD 錠 20mg「明治」 : 錠剤（素錠、口腔内崩壊錠）

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	剤形	色	外形		
			表	裏	側面
ビラスチン錠 20mg「明治」	素錠	白色			
			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
			7.0	2.6	125
ビラスチン OD 錠 20mg「明治」	素錠	白色			
			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
			8.0	2.9	180

#### (3) 識別コード

ビラスチン錠 20mg「明治」 : MS132  
 ビラスチン OD 錠 20mg「明治」 : MS131

#### (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

販売名	有効成分(1錠中)	添加剤
ビラスチン錠 20mg「明治」	ビラスチン 20mg	結晶セルロース、デンプングリコール酸ナトリウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム
ビラスチン OD 錠 20mg「明治」	ビラスチン 20mg	D-マンニトール、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、クロスポビドン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物） 香料

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当資料なし

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

有効成分の類縁物質が混入する可能性がある。

6. 製剤の各種条件下における安定性

ビラスチン錠 20mg 「明治」

①加速試験<sup>2)</sup>

保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
40℃、75%RH	PTP 包装 (ポリプロピレン、アルミニウム箔/紙箱)	6 ヶ月	規格内

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性、溶出性、定量法

ビラスチン OD 錠 20mg 「明治」

①加速試験<sup>3)</sup>

保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
40℃、75%RH	PTP 包装 (ポリプロピレン、アルミニウム箔/紙箱)	6 ヶ月	規格内

試験項目：性状、確認試験、純度試験 類縁物質、水分、製剤均一性、崩壊性、溶出性、定量法

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）

該当資料なし

9. 溶出性

＜溶出挙動における類似性＞

ビラスチン錠 20mg 「明治」<sup>4)</sup>

「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」（別紙 1）

薬生薬審発 0319 第 1 号（令和 2 年 3 月 19 日付）

試験方法及び試験条件

試験方法：日本薬局方 溶出試験法（パドル法）

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2（溶出試験第 1 液）

②pH4.0（薄めた McIlvaine の緩衝液）

③pH6.8（溶出試験第 2 液）

④水

回転数：毎分 50 回転（試験液①～④）、毎分 100 回転（試験液③）

試験回数：12 ベッセル

## 判定基準

### <平均溶出率>

pH1.2（毎分 50 回転）、pH6.8（毎分 100 回転）

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にある。

pH4.0（毎分 50 回転）、pH6.8（毎分 50 回転）

標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 15\%$ の範囲にある。

水（毎分 50 回転）

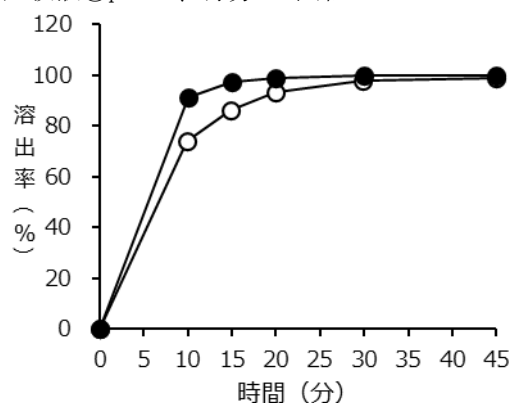
標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 15\%$ の範囲にある。

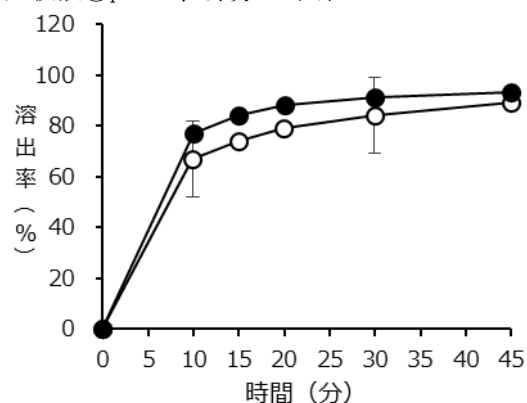
## 試験結果

ビラスチン錠 20 mg「明治」は、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出試験の項に従って試験を行った結果、規定されたすべての溶出試験条件において類似性の判定基準に適合し、標準製剤との溶出挙動は類似していると判定された。

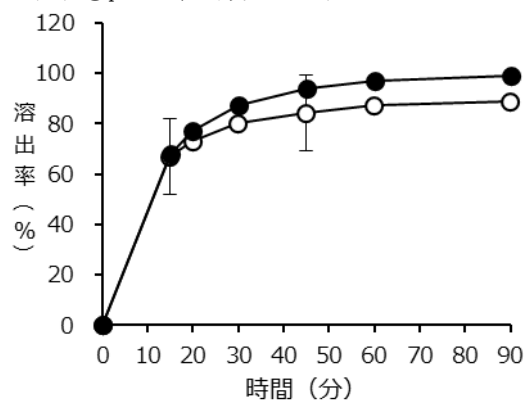
試験液①pH1.2、毎分 50 回転



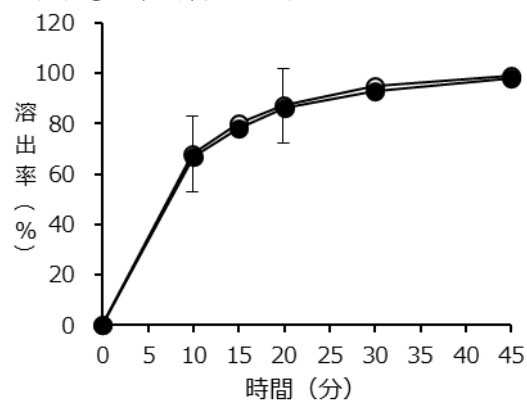
試験液②pH4.0、毎分 50 回転



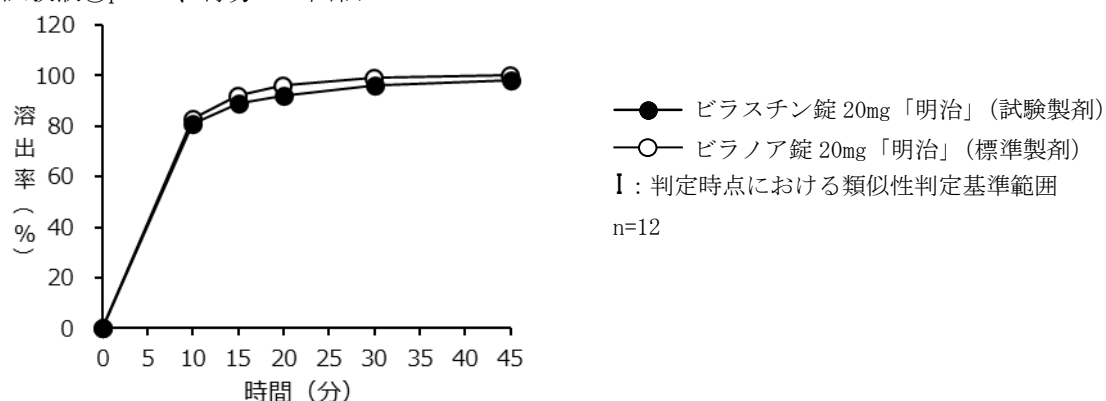
試験液③pH6.8、毎分 50 回転



試験液④水、毎分 50 回転



試験液③pH6.8、毎分 100 回転



図IV-1 ビラスチン錠 20mg 「明治」の溶出挙動における類似性  
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

表IV-1 ビラスチン錠 20mg 「明治」の溶出挙動における類似性  
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件		判定時点	平均溶出率 (%)		判定
試験法/回転数	試験液		ビラスチン錠20mg 「明治」 (試験製剤)	ビラノア錠20mg (標準製剤)	
パドル法 毎分 50 回転	pH1.2	15 分	97	86	適合
	pH4.0	10 分	77	67	適合
		30 分	91	84	
	pH6.8	15 分	68	67	適合
		45 分	94	84	
パドル法 毎分 100 回転	水	10 分	67	68	適合
		20 分	86	87	
パドル法 毎分 100 回転	pH6.8	15 分	89	92	適合

ビラスチン OD 錠 20mg 「明治」<sup>5)</sup>

「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」(別紙 1)

薬生薬審発 0319 第 1 号 (令和 2 年 3 月 19 日付)

#### 試験方法及び試験条件

試験方法：日本薬局方 溶出試験法 (パドル法)

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2 (溶出試験第 1 液)

②pH5.0 (薄めた McIlvaine の緩衝液)

③pH6.8 (溶出試験第 2 液)

④水

回転数：毎分 50 回転 (試験液①～④) ※

試験回数：12 ベッセル

※pH5.0 において、パドル法 50 回転で 30 分以内に標準製剤及び試験製剤ともに平均溶出率が 85%を超えているものであった為、パドル法 100 回転の試験は省略することとした。

#### 判定基準

##### <平均溶出率>

pH1.2 (毎分 50 回転)、pH5.0 (毎分 50 回転)、pH6.8 (毎分 50 回転)、水 (毎分 50 回転)

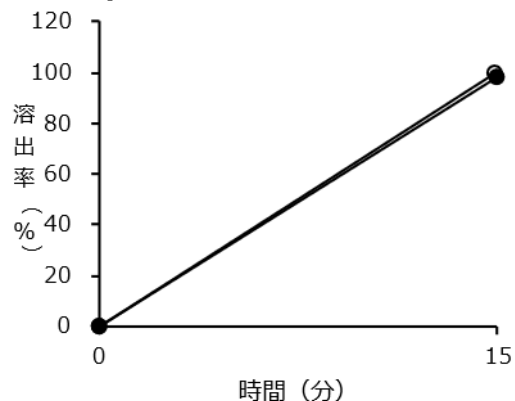
標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

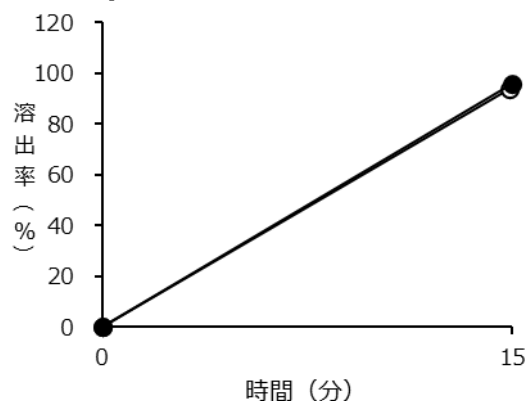
## 試験結果

ビラスチン OD 錠 20 mg「明治」は、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出試験の項に従って試験を行った結果、規定されたすべての溶出試験条件において類似性の判定基準に適合し、標準製剤との溶出挙動は類似していると判定された。

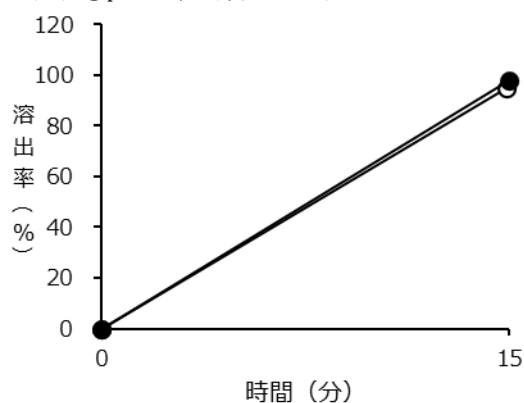
試験液①pH1.2、毎分 50 回転



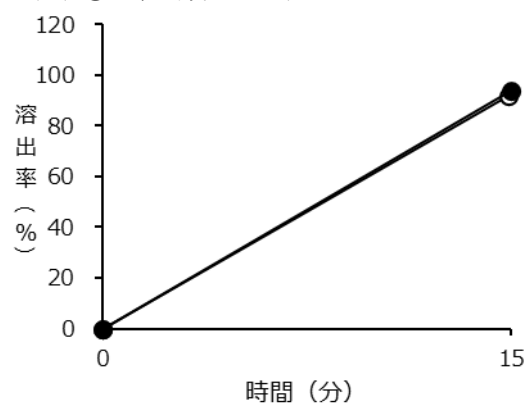
試験液②pH5.0、毎分 50 回転



試験液③pH6.8、毎分 50 回転



試験液④水、毎分 50 回転



● ビラスチン OD 錠 20mg「明治」(試験製剤)  
○ ビラノア OD 錠 20mg「明治」(標準製剤)

n=12

図IV-2 ビラスチン OD 錠 20mg「明治」の溶出挙動における類似性  
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

表IV-2 ビラスチン OD 錠 20mg「明治」の溶出挙動における類似性  
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件		判定時点	平均溶出率(%)		判定
試験法/回転数	試験液		ビラスチンOD錠20mg「明治」 (試験製剤)	ビラノアOD錠20mg (標準製剤)	
パドル法 毎分 50 回転	pH1.2	15 分	98	100	適合
	pH5.0	15 分	96	94	適合
	pH6.8	15 分	98	95	適合
	水	15 分	94	92	適合

## 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

ビラスチン錠 20mg 「明治」

PTP 包装 100 錠 (10 錠×10) 500 錠 (10 錠×50)

ビラスチン OD 錠 20mg 「明治」

PTP 包装 100 錠 (10 錠×10) 500 錠 (10 錠×50)

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

PTP シート：ポリプロピレン、アルミニウム箔

バンド：ポリプロピレン

外箱：紙

## 11. 別途提供される資材類

該当資料なし

## 12. その他

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 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

通常、成人にはピラスチンとして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

該当しない

#### (2) 臨床薬理試験

##### 1) 心血管系へ及ぼす影響

健康成人（30例）を対象に、ピラスチン錠20mg、ピラスチン錠100mg<sup>#1</sup>、ピラスチン錠20mg＋ケトコナゾール<sup>#2</sup>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<sup>a</sup>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<sup>6)</sup>（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

#1 本剤の承認された用法・用量は「V.3. 用法及び用量」の項参照

#2 経口剤は国内未承認。

<電子添文 17.3.2 より転記>

#### (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

〈アレルギー性鼻炎〉

##### 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、ピラスチン錠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<sup>a)</sup>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<sup>7-9)</sup>。

表 V-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 <sup>b)</sup>	Day 10～13	変化量 <sup>a)</sup>	プラセボとの差 <sup>c)</sup>
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。

<電子添文 17.1.1 より転記>

〈蕁麻疹〉

## 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）<sup>#1</sup>、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<sup>a)</sup>」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<sup>10,11)</sup>。

表 V-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 <sup>b)</sup>	Day 8～14	変化量 <sup>a)</sup>	プラセボとの差 <sup>c)</sup>
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。

#1 本剤の承認された用法・用量は「V.3.用法及び用量」の項参照

<電子添文 17.1.2 より転記>

〈皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒〉

## 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 20mg1 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<sup>12)</sup>。

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。

<電子添文 17.1.3 より転記>

## 2) 安全性試験

該当資料なし

## (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

該当しない

### 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

### 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<sup>#1</sup>、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<sup>13)</sup>（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<sup>#1</sup>、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<sup>14)</sup>（外国人データ）。[16. 3. 2 参照]

#1 本剤の承認された用法・用量は「V. 3. 用法及び用量」の項参照

<電子添文 17. 3. 1 より転記>

## 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

フェキソフェナジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、ロラタジン、デスロラタジン、ベポタスチンベシル酸塩<sup>15)</sup>

注意：関連のある化合物の効能・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

ビラスチンはヒスタミン  $H_1$  受容体拮抗作用及び抗アレルギー作用を示す。

<電子添文 18.1 より転記>

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) ヒスタミン $H_1$ 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  $H_1$  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<sup>16-18)</sup>。

<電子添文 18.2 より転記>

##### 2) 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 ( $IC_{50}$  値：95.5nmol/L)<sup>16,17)</sup> (*in vitro*)。

<電子添文 18.3 より転記>

#### (3) 作用発現時間・持続時間

「V.5.(4) 1) 有効性検証試験」の項参照

# 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

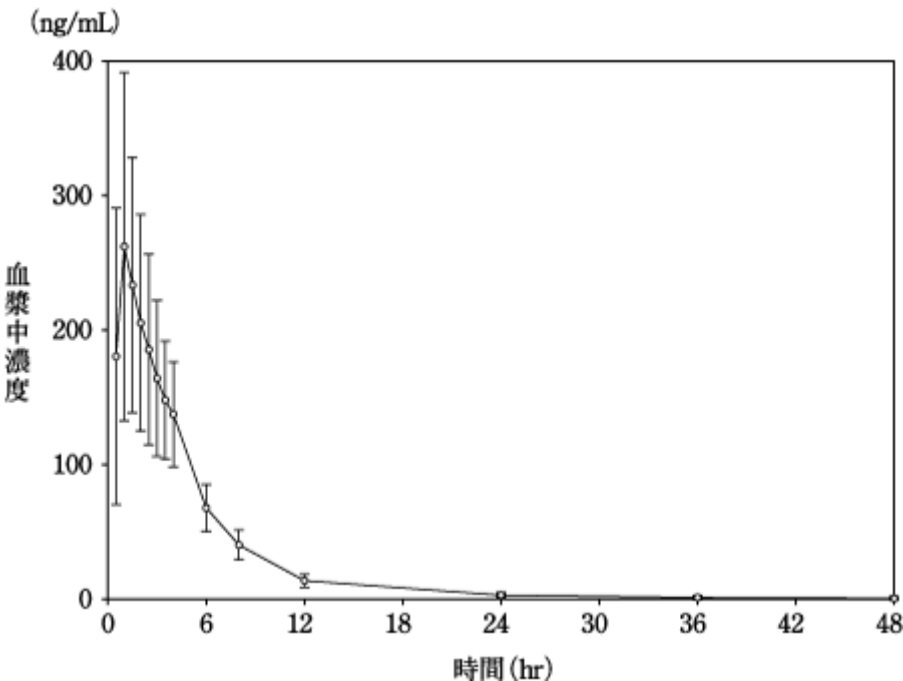
### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

#### 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<sup>19)</sup>。

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

#1 本剤の承認された用法・用量は「V. 3. 用法及び用量」の項参照



図VII-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VII-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 <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	AUC <sub>0-inf</sub> (ng・hr/mL)	t <sub>1/2</sub> (hr)
20	277.86 (117.40)	1.00 (0.5-2.5)	1296.45 <sup>a</sup> (368.26)	10.54 <sup>a</sup> (5.50)

空腹時投与、平均値（標準偏差）20 例 [a : 19 例]、t<sub>max</sub> は中央値（最小値-最大値）

<電子添文 16.1.1 より転記>

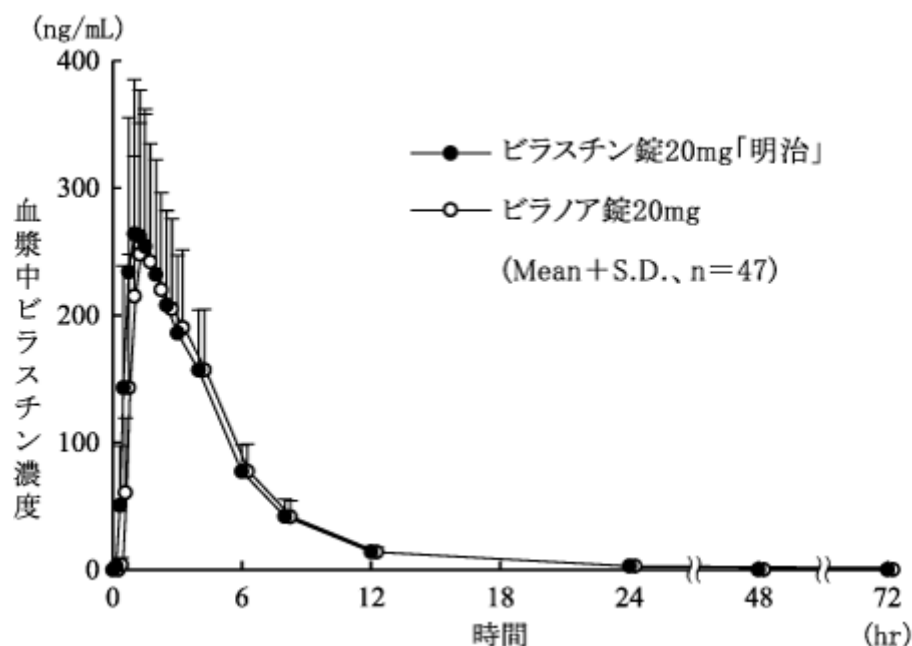
## 2) 生物学的同等性試験

ビラスチン錠 20mg 「明治」

「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」(別紙 1)

薬生薬審発 0319 第 1 号 (令和 2 年 3 月 19 日付)

ビラスチン錠 20mg 「明治」とビラノア錠 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、いずれも  $\log (0.80) \sim \log (1.25)$  の範囲内であり、それぞれ両剤の生物学的同等性が確認された<sup>21)</sup>。



図VII-2 20mg 錠投与時の血漿中ビラスチン濃度推移

表VII-2 薬物動態パラメータ

	被験者数	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUCt (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ビラスチン錠 20mg 「明治」	47	1377.0 ± 377.3	293 ± 120	1.37 ± 0.80	8.44 ± 5.17
ビラノア錠 20mg	47	1351.6 ± 343.0	295 ± 108	1.37 ± 0.76	8.61 ± 4.97

Mean ± S. D.

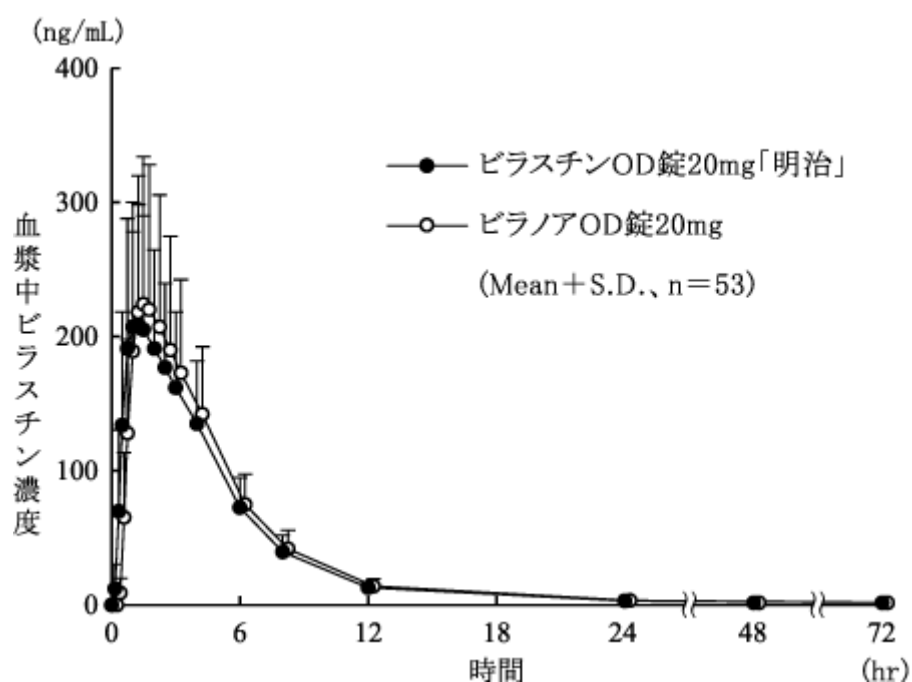
血漿中濃度並びに AUC、C<sub>max</sub> 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

ビラスチン OD 錠 20mg 「明治」

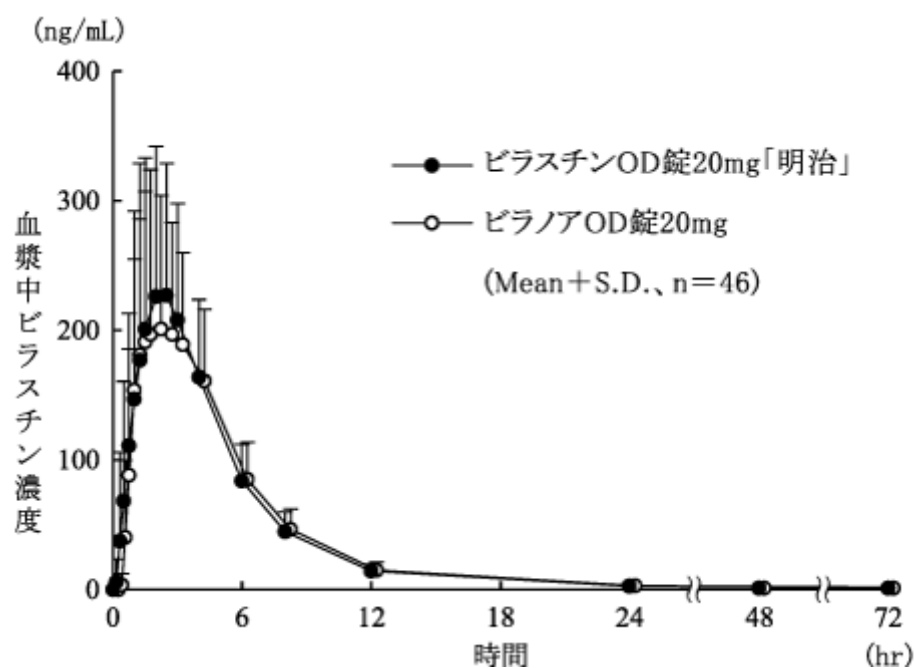
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」(別紙 1)

薬生薬審発 0319 第 1 号 (令和 2 年 3 月 19 日付)

ビラスチン OD 錠 20mg 「明治」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) 健康成人男子に絶食時水あり、絶食時水なしの条件下、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、いずれも  $\log (0.80) \sim \log (1.25)$  の範囲内であり、それぞれ両剤の生物学的同等性が確認された<sup>22)</sup>。



図VII-3 20mgOD 錠投与時の血漿中ピラスチン濃度推移（水あり服用）



図VII-4 20mgOD 錠投与時の血漿中ピラスチン濃度推移（水なし服用）

表VII-3 薬物動態パラメータ

		被験者数	判定パラメータ		参考パラメータ	
			AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
水あり服用	ピラスチン OD 錠 20mg 「明治」	53	1211.1 ± 352.9	228 ± 93.1	1.35 ± 0.65	7.29 ± 3.12
	ピラノア OD 錠 20mg	53	1277.6 ± 414.8	249 ± 111	1.28 ± 0.66	7.96 ± 4.44
水なし服用	ピラスチン OD 錠 20mg 「明治」	46	1313.1 ± 396.9	278 ± 114	1.79 ± 0.84	8.58 ± 6.28
	ピラノア OD 錠 20mg	46	1313.7 ± 407.3	266 ± 115	1.71 ± 0.95	8.58 ± 5.84

Mean ± S. D.

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。

### (3) 中毒域

該当資料なし

### (4) 食事・併用薬の影響

#### 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）<sup>#1</sup> 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<sub>max</sub> 及び AUC<sub>0-t</sub> はそれぞれ約 60% 及び約 40% 低下した<sup>19)</sup>。

#1 本剤の承認された用法・用量は「V. 3. 用法及び用量」の項参照

<電子添文 16. 2. 1 より転記>

#### 2) 併用薬の影響

##### 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<sub>max</sub> 及び AUC<sub>0-24</sub> はそれぞれ約 2. 9 倍及び約 1. 9 倍に上昇した<sup>23)</sup>（外国人データ）。[10. 2 参照]

<電子添文 16. 7. 1 より転記>

##### 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<sup>#2</sup>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<sub>max</sub> 及び AUC<sub>0-24</sub> はそれぞれ約 2. 6 倍及び約 2 倍に上昇した<sup>24)</sup>（外国人データ）。

#2 経口剤は国内未承認

<電子添文 16. 7. 2 より転記>

##### 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<sub>max</sub> 及び AUC<sub>0-inf</sub> はそれぞれ約 1. 5 倍及び約 1. 3 倍に上昇した<sup>25)</sup>（外国人データ）。[10. 2 参照]

<電子添文 16. 7. 3 より転記>

##### 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<sub>max</sub> 及び AUC<sub>0-inf</sub> 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<sup>26)</sup>（外国人データ）。

<電子添文 16. 7. 4 より転記>

「VIII. 7. 相互作用」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<sup>21, 22)</sup>

薬剤名		N数	消失速度定数 $k_{el}$ (hr <sup>-1</sup> )
ビラスチン錠20mg「明治」		47	0.1131±0.0611
ビラスチンOD錠20mg「明治」	水なし	46	0.1179±0.0618
	水あり	53	0.1105±0.0438

(健康成人男子単回投与、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

「VII. 1. (4) 食事・併用薬の影響」の項参照

### 5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

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 H<sub>1</sub> 受容体の占拠は認めなかった<sup>27)</sup>（外国人データ）。[17. 3. 1 参照]

<電子添文 16. 3. 2 より転記>

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(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

ビラスチンの *in vitro* ヒト血漿蛋白結合率は 0.2～1  $\mu$ g/mL の濃度範囲において、84.22～90.04% であった<sup>28)</sup>。

<電子添文 16.3.1 より転記>

### 6. 代謝

#### (1) 代謝部位及び代謝経路

健康成人男性 6 例に <sup>14</sup>C-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<sup>29, 30)</sup> (外国人データ)。

<電子添文 16.4 より転記>

#### (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

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<sup>20)</sup>。

健康成人男性 6 例に <sup>14</sup>C-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<sup>29, 30)</sup> (外国人データ)。[9.8 参照]

<電子添文 16.5 より転記>

### 8. トランスポーターに関する情報

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<sup>31)</sup>。

<電子添文 16.7 より転記>

### 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

#### (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<sup>32)</sup> (外国人データ)。[9.2.1 参照]

表Ⅶ-4 腎機能障害患者にピラスチン錠 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 <sup>2</sup> )]	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	AUC <sub>0-inf</sub> (ng・hr/mL)	t <sub>1/2</sub> (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<sub>max</sub> は中央値 (最小値-最大値)

< 電子添文 16.6.1 より転記 >

## (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) にピラスチン錠 20mg を単回経口投与したとき、若齢男性と高齢男性ではピラスチンの C<sub>max</sub> 及び AUC<sub>0-inf</sub> に差はなかった。若齢女性と高齢女性ではピラスチンの C<sub>max</sub> は若齢女性が 1.7 倍高かったが、AUC<sub>0-inf</sub> に差はなかった<sup>33)</sup> (外国人データ)。

< 電子添文 16.6.2 より転記 >

## 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]

「VII. 10. 特定の背景を有する患者」の項参照

## 7. 相互作用

### 10. 相互作用

ビラスチンはP糖蛋白の基質である<sup>31)</sup>。

### (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。

「VII. 1. (1) 食事・併用薬の影響」の項参照

## 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		
種類\頻度	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、 $\gamma$ -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、アレルゲン皮内反応を抑制するため、アレルゲン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

##### 〈製剤共通〉

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。

##### 〈OD 錠〉

14.1.2 本剤は舌の上にのせ唾液を浸潤させ、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：ビラスチン錠 20mg「明治」 処方箋医薬品<sup>注)</sup>

ビラスチン OD 錠 20mg「明治」 処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：ビラスチン 劇薬

### 2. 有効期間

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

設定されていない

### 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：準備中

その他の患者向け資材：あり

＜患者向け指導箋＞

ビラスチン錠・OD 錠「明治」を服薬される方へ（販売開始時に提供）

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ビラノア錠 20mg、ビラノア OD 錠 20mg

同 効 薬：フェキソフェナジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、ロラタジン、デスロラタジン、ベポタスチンベシル酸塩

### 7. 国際誕生年月日

該当資料なし

### 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

販売名	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
ビラスチン錠 20mg「明治」	2026 年 2 月 16 日	30800AMX00028000	薬価基準未収載	
ビラスチン OD 錠 20mg「明治」	2026 年 2 月 16 日	30800AMX00029000	薬価基準未収載	

### 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	個別医薬品コード (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
ビラスチン錠 20mg「明治」	薬価基準未収載			
ビラスチン OD 錠 20mg「明治」	薬価基準未収載			

### 14. 保険給付上の注意

該当しない



## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) Use of stems in the selection of International Nonproprietary Names (INN) for pharmaceutical substances 2024 (Stem Book 2024) (World Health Organization)
- 2) ビラスチン錠 20mg「明治」の安定性に関する資料（加速試験）（社内資料）
- 3) ビラスチン OD 錠 20mg「明治」の安定性に関する資料（加速試験）（社内資料）
- 4) ビラスチン錠 20mg「明治」の溶出試験に関する資料（社内資料）
- 5) ビラスチン OD 錠 20mg「明治」の溶出試験に関する資料（社内資料）
- 6) Tyl B, et al. : J Clin Pharmacol. 2012 ; 52 (6) : 893-903 (PMID : 21642470)
- 7) Okubo K, et al. : Allergol Int. 2017 ; 66 (1) : 97-105 (PMID : 27421817)
- 8) 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、CTD2. 7. 6. 24）
- 9) ビラノア錠：2016 年 9 月 28 日承認、審査報告書
- 10) Hide M, et al. : Allergol Int. 2017 ; 66 (2) : 317-325 (PMID : 27599913)
- 11) 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、CTD2. 7. 6. 33）
- 12) Yagami A, et al. : J Dermatol. 2017 ; 44 (4) : 375-385 (PMID : 27862227)
- 13) Conen S, et al. : J Psychopharmacol. 2011 ; 25 (11) : 1517-1523 (PMID : 20855350)
- 14) García-Gea C, et al. : J Clin Psychopharmacol. 2008 ; 28 (6) : 675-685 (PMID : 19011437)
- 15) 薬剤薬剤分類情報閲覧システム  
<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>（2026/2/3 アクセス）
- 16) Corcóstegui R, et al. : Drugs R D. 2005 ; 6 (6) : 371-384 (PMID : 16274260)
- 17) Corcóstegui R, et al. : Drugs R D. 2006 ; 7 (4) : 219-231 (PMID : 16784247)
- 18) 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、CTD2. 6. 2. 2）
- 19) 「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、CTD2. 7. 1. 2、2. 7. 6. 1）
- 20) 「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、CTD2. 7. 2. 2、2. 7. 6. 5）
- 21) ビラスチン錠 20mg「明治」の生物学的同等性試験に関する資料（社内資料）
- 22) ビラスチン OD 錠 20mg「明治」の生物学的同等性試験に関する資料（社内資料）
- 23) 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、CTD2. 7. 2. 2、2. 7. 6. 12）
- 24) 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、CTD2. 7. 2. 2、2. 7. 6. 13）
- 25) A phase 1, open-label, randomized, 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、CTD2. 7. 2. 2、2. 7. 6. 14）
- 26) A phase 1, open-label, randomized, 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、CTD2. 7. 2. 2、2. 7. 6. 15）
- 27) Farré M, et al. : Br J Clin Pharmacol. 2014 ; 78 (5) : 970-980 (PMID : 24833043)
- 28) 血漿蛋白結合（ビラノア錠：2016 年 9 月 28 日承認、CTD2. 6. 4. 4）
- 29) A phase I study to investigate the absorption, metabolism and excretion of [<sup>14</sup>C]-bilastine following oral administration to healthy volunteers（ビラノア錠：2016 年 9 月 28 日承認、CTD2. 7. 2. 2、2. 7. 6. 7）
- 30) <sup>14</sup>C 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、CTD2. 7. 2. 2）

- 31) 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、CTD2.7.2.2)
- 32) 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、CTD2.7.2.2、2.7.6.11)
- 33) 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、CTD2.7.2.2、2.7.6.10)

## 2. その他の参考文献

該当しない

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

海外における発売状況は以下の通りである。(2026年1月時点)

国名	販売名
英国	Bilastine 20mg Tablets 他

注) 上記品目については、ライセンス関係のない企業が販売している。

本邦における承認された効能・効果及び用法・用量は以下の通りであり、外国での承認状況と異なる。

#### 4. 効能・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

#### 6. 用法・用量

通常、成人にはピラスチンとして1回20mgを1日1回空腹時に経口投与する。

### 2. 海外における臨床支援情報

#### (1) 妊婦に関する海外情報（SmPC、オーストラリア分類）

本邦における特定の背景を有する患者に関する注意「9.5 妊婦」「9.6 授乳婦」の項の記載は以下の通りであり、英国のSmPC及びオーストラリア分類とは異なる。

#### 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

##### 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。

##### 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。

出典	記載内容
英国のSmPC (2025年3月)	<b>4.6 Fertility, pregnancy and lactation</b> <b>Pregnancy:</b> There are no or limited amount of data from the use of bilastine in pregnant women. Animal studies do not indicate direct or indirect harmful effects with respect to reproductive toxicity, parturition or postnatal development. As a precautionary measure, it is preferable to avoid the use of bilastine during pregnancy. <b>Breast-feeding:</b> The excretion of bilastine in milk has not been studied in humans. Available pharmacokinetic data in animals have shown excretion of bilastine in milk. A decision on whether to continue/discontinue breast-feeding or to discontinue/abstain from bilastine therapy must be made taking into account the benefit of breast-feeding for the child and the benefit of bilastine therapy for the mother. <b>Fertility:</b> There are no or limited amount of clinical data. A study in rats did not indicate any negative effect on fertility.

オーストラリアの分類	分類
An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy	B3*

\*<https://www.tga.gov.au/products/medicines/find-information-about-medicine/prescribing-medicines-pregnancy-database>  
(2026/1/28 アクセス)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類 (The Australian categories for prescribing medicines in pregnancy)

B3 : Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals have shown evidence of an increased occurrence of fetal damage, the significance of which is considered uncertain in humans.

(2) 小児等への投与に関する情報

本邦における特定の背景を有する患者に関する注意「9.7 小児等」の項の記載は以下のとおりであり、英国の SmPC とは異なる。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

出典	記載内容
英国の SmPC (2025 年 3 月)	<p><b>4.2 Posology and method of administration</b>  <b>Paediatric population</b>  - Children 6 to 11 years of age with a body weight of at least 20 kg  Bilastine 10 mg orodispersible tablets and bilastine 2.5 mg/mL oral solution are appropriate for administration to this population.  - Children under 6 years of age and under 20 kg  Currently available data are described in section 4.4, 4.8, 5.1 and 5.2 but no recommendation on a posology can be made. Therefore bilastine should not be used in this age group.  The safety and efficacy of bilastine in renally and hepatically impaired children have not been established.</p> <p><b>4.4 Special warnings and precautions for use</b>  <b>Paediatric population</b>  Efficacy and safety of bilastine in children under 2 years of age have not been established and there is little clinical experience in children aged 2 to 5 years, therefore bilastine should not be used in these age groups.  In patients with moderate or severe renal impairment coadministration of bilastine with P-glycoprotein inhibitors, such as e.g. ketoconazole, erythromycin, cyclosporine, ritonavir or diltiazem, may increase plasmatic levels of bilastine and therefore increase the risk of adverse effects of bilastine. Therefore, coadministration of bilastine and P-glycoprotein inhibitors should be avoided in patients with moderate or severe renal impairment.  Cases of Electrocardiogram QT prolonged have been reported in patients using bilastine. Medicinal products that cause QT/QTc prolongation are suspected to increase the risk of Torsade de pointes.  Therefore, caution should be exercised when administering bilastine to patients who are at increased risk of experiencing QT/QTc-prolongation. This includes patients with a history of cardiac arrhythmias; patients with hypokalemia, hypomagnesaemia, hypocalcemia; patients with known prolongation of the QT interval or significant bradycardia; patients with concomitant use of other medicinal products associated with QT/QTc-prolongation.</p> <p><b>4.5 Interaction with other medicinal products and other forms of interaction</b>  <b>Paediatric population</b>  Interaction studies have only been performed in adults. As there is no clinical experience regarding the interaction of bilastine with other medicinal products, food or fruit juices in children, the results obtained in adult interactions studies should be at present taken into consideration when prescribing bilastine to children. There are no clinical data in children to state whether changes to the AUC or Cmax due to interactions affect the safety profile of bilastine.</p>

## 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

#### (1) 粉碎

個別に照会すること。

問い合わせ先：Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室

TEL (03) 3273-3539 (0120) 093-396 FAX (03) 3272-2438

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること。

問い合わせ先：Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室

TEL (03) 3273-3539 (0120) 093-396 FAX (03) 3272-2438

### 2. その他の関連資料

# MEMO

-----

-----

-----

-----

-----



製造販売元

**Meiji Seika ファルマ株式会社**  
東 京 都 中 央 区 京 橋 2 - 4 - 16

IFBT024401