2026年10月改訂(第２版)
2026年 ２月作成(第１版)

貯法：室温保存
有効期間：3年

02

日本標準商品分類番号
87449

承認番号	販売開始
30800AMX00060	2026年 6 月

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「EP」

BILASTINE OD TABLETS「EP」

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. 組成・性状

3.1 組成

販売名	有効成分	添加剤
ビラスチンOD錠20mg「EP」	1錠中 ビラスチン20mg	D-マンニトール・低置換度ヒドロキシプロピルセルロース・ポリビニルアルコール(完全けん化物)造粒物、クロスポビドン、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、ステアリン酸マグネシウム、香料

3.2 製剤の性状

販売名	剤形	色	外形			識別コード
			直径(mm)	厚さ(mm)	質量(mg)	
ビラスチンOD錠20mg「EP」	口腔内崩壊錠	白色				BD EP
			8.0	2.9	180	

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

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。

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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 中等度(30≦GFR＜50mL/min/1.73m²)又は重度(GFR＜30mL/min/1.73m²)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]

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。

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。

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]

10. 相互作用

ビラスチンはP糖蛋白の基質である[1)]。

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。

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。

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)

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

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。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

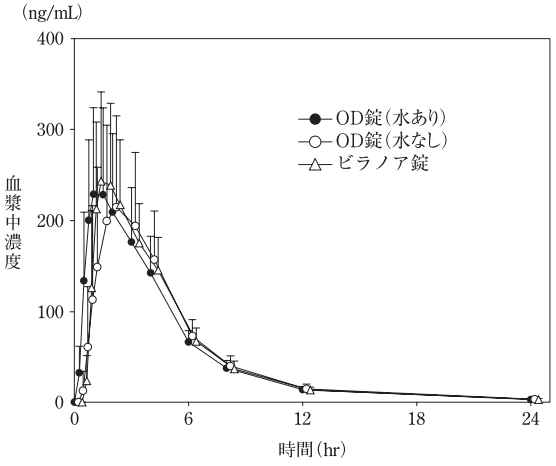
14.1.1 PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。
14.1.2 本剤は舌の上にのせ唾液を浸潤させ、崩壊後唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

健康成人男性59例にビラスチンOD錠20mg「EP」(口腔内崩壊錠：以下OD錠)(水あり又は水なしで服用)とビラノア錠20mg(水で服用)を空腹時単回経口投与したとき、いずれにおいても生物学的に同等であることが確認された[2)]。

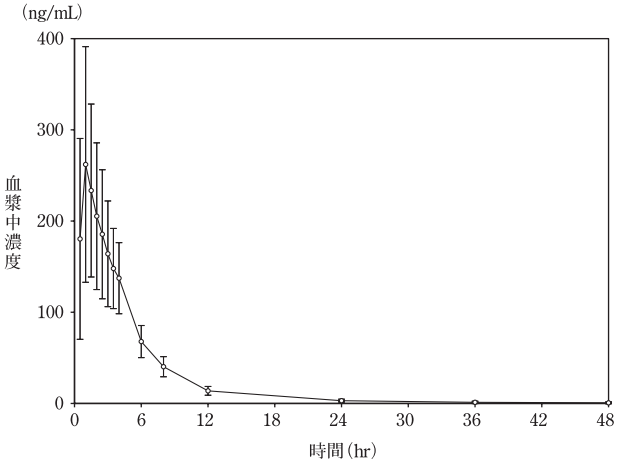


OD錠(水あり又は水なし)及びビラノア錠の単回経口投与時のビラスチン血漿中濃度
空腹時投与、平均値+標準偏差(各59例)

剤形	Cmax (ng/mL)	$AUC_{0\text{-}24}$ (ng・hr/mL)
OD錠(水あり)	263.90(98.02)	1210.07(281.06)
OD錠(水なし)	261.73(90.95)	1190.87(282.85)
ビラノア錠	273.37(94.91)	1222.72(264.24)

59例、平均値(標準偏差)

16.1.2 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[3)]。
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[4)]。
注1)本剤の承認用量は1回20mg、1日1回である。



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)

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)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$AUC_{0\text{-}inf}$ (ng・hr/mL)	$t_{1/2}$ (hr)
20	277.86 (117.40)	1.00 (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]、Tmaxは中央値(最小値-最大値)

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Cmax及び$AUC_{0\text{-}t}$はそれぞれ約60%及び約40%低下した[3)]。

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0.2～1μg/mLの濃度範囲において、84.22～90.04%であった[5)]。

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H_1受容体の占拠は認めなかった[6)](外国人データ)。[17.3.1 参照]

16.4 代謝

健康成人男性6例に^{14}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[7)、8)](外国人データ)。

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。
健康成人男性6例に^{14}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[4)、7)、8)](外国人データ)。[9.8 参照]

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Cmax及び$AUC_{0\text{-}inf}$は健康成人に比べそれぞれ1.6倍及び2.3倍高かった[9)](外国人データ)。[9.2.1 参照]

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/1.73m²)]	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$AUC_{0\text{-}inf}$ (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)、Tmax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Cmax及び$AUC_{0\text{-}inf}$に差はなかった。若齢女性と高齢女性ではビラスチンのCmaxは若齢女性が1.7倍高かったが、$AUC_{0\text{-}inf}$に差はなかった[10)](外国人データ)。

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[1)]。

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Cmax及び$AUC_{0\text{-}24}$はそれぞれ約2.9倍及び約1.9倍に上昇した[11)](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Cmax及び$AUC_{0\text{-}24}$はそれぞれ約2.6倍及び約2倍に上昇した[12)](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Cmax及び$AUC_{0\text{-}inf}$はそれぞれ約1.5倍及び約1.3倍に上昇した[13)](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Cmax及び$AUC_{0\text{-}inf}$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[14](外国人データ)。

注2)経口剤は国内未承認。

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[15)-17)]。

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(発疹、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[18)-20)]。

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] p値：<0.001
プラセボ群	95	4.49 ±0.95	3.02 ±1.32	-1.47 ±1.24	

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。

〈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[21)]。

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[22)](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[23)](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、ビラスチン錠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[24)](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。

18. 薬効薬理

18.1 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。

18.2 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(Ki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[25)-27)]。

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(IC_{50}値：95.5nmol/L)[25)、26)](*in vitro*)。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：ビラスチン(Bilastine)

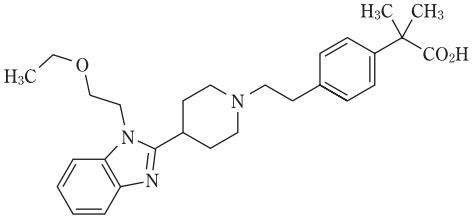
化学名：2-[4-(2-{4-[1-(2-Ethoxyethyl)-1*H*-benzimidazol-2-yl]piperidin-1-yl}ethyl)phenyl]-2-methylpropanoic acid

分子式：$C_{28}H_{37}N_3O_3$

分子量：463.61

性　状：白色の結晶性の粉末である。メタノールに溶けにくく、水又はエタノール(99.5)にほとんど溶けない。

構造式：



融　点：200.0～202.2℃

22. 包装

(PTP)　100錠(10錠×10)、420錠(14錠×30)、500錠(10錠×50)

23. 主要文献

1) トランスポーター(ビラノア錠：2016年9月28日承認、CTD2.7.2.2)
2) 社内資料：健康成人を対象としたTAC-202錠とTAC-202OD錠の生物学的同等性試験
3) 「TAC-202の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)
4) 「健康成人男性を対象としたTAC-202の臨床第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)
5) Bilastine. Plasma protein binding(ビラノア錠：2016年9月28日承認、CTD2.6.4.4)
6) Farré M, et al.：Br J Clin Pharmacol. 2014；78(5)：970-980
7) A phase I study to investigate the absorption, metabolism and excretion of[^{14}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)
8) ヒトマスバランス(ビラノア錠：2016年9月28日承認、CTD2.7.2.2)
9) 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)
10) 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)
11) 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)
12) 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)
13) 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、CTD2.7.2.2、2.7.6.14)
14) 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、CTD2.7.2.2、2.7.6.15)
15) Okubo K, et al.：Allergol Int. 2017；66(1)：97-105
16) 通年性アレルギー性鼻炎患者を対象としたTAC-202の臨床第Ⅲ相試験(ビラノア錠：2016年9月28日承認、CTD2.7.6.24)
17) 通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした国内第Ⅲ相試験(ビラノア錠：2016年9月28日　審査報告書)
18) Hide M, et al.：Allergol Int. 2017；66(2)：317-325
19) 慢性蕁麻疹患者を対象としたTAC-202の臨床第Ⅱ/Ⅲ相試験(ビラノア錠：2016年9月28日承認、CTD2.7.6.33)
20) 慢性蕁麻疹患者を対象とした国内第Ⅱ/Ⅲ相試験(ビラノア錠：2016年9月28日　審査報告書)
21) Yagami A, et al.：J Dermatol. 2017；44(4)：375-385
22) Conen S, et al.：J Psychopharmacol. 2011；25(11)：1517-1523
23) García-Gea C, et al.：J Clin Psychopharmacol. 2008；28(6)：675-685
24) Tyl B, et al.：J Clin Pharmacol. 2012；52(6)：893-903
25) Corcóstegui R, et al.：Drugs R D. 2005；6(6)：371-384
26) Corcóstegui R, et al.：Drugs R D. 2006；7(4)：219-231
27) モルモットのヒスタミン誘発気道血管透過性亢進に対する作用(ビラノア錠：2016年9月28日承認、CTD2.6.2.2)

24. 文献請求先及び問い合わせ先

第一三共エスファ株式会社　お客様相談室
〒103-0027　東京都中央区日本橋2-13-12
TEL：0120-100-601

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

第一三共エスファ株式会社
Daiichi-Sankyo
東京都中央区日本橋本町3-5-1

26.2 販売提携

第一三共株式会社
Daiichi-Sankyo
東京都中央区日本橋本町3-5-1