

*2023年10月改訂(第2版)

2023年9月改訂(第1版)

貯法：室温保存
有効期間：60ヵ月

吸虫駆除剤
プラジカンテル錠
処方箋医薬品^{注)}

日本標準商品分類番号

876429

承認番号

22100AMX00735000

販売開始

1989年1月



ビルトリシド錠600mg

Biltricide tablets 600mg

注)注意—医師等の処方箋により使用すること

D6

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
- 2.2 有鉤囊虫(条虫)症患者[寄生部位によっては、死滅虫体により回復困難な病変(失語症、片麻痺、脳梗塞等の中樞神経障害、眼障害等)を引き起こすことがある。]
- 2.3 リファンピシンを投与中の患者[10.1 参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

| | |
|------|---|
| 販売名 | ビルトリシド錠600mg |
| 有効成分 | 1錠中プラジカンテル600mg含有 |
| 添加剤 | トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ポビドン、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール4000、酸化チタン |

3.2 製剤の性状

| | |
|-------|---|
| 販売名 | ビルトリシド錠600mg |
| 剤形 | 長円形のフィルムコーティング錠(割線あり) |
| 色調 | 白色～橙色を帯びた白色 |
| 外形 |  |
| 長径 | 22.2mm |
| 短径 | 8.2mm |
| 厚さ | 6.4mm |
| 質量 | 912.0mg |
| 識別コード | LG BAYER |

4. 効能又は効果

- 肝吸虫症
- 肺吸虫症
- 横川吸虫症

6. 用法及び用量

(肝吸虫症、肺吸虫症)

プラジカンテルとして、1回20mg/kgを1日2回2日間経口投与する。

(横川吸虫症)

プラジカンテルとして、1回20mg/kgを1日1～2回1日経口投与する。

7. 用法及び用量に関連する注意

- 7.1 1回投与量20mg/kgは、患者の体重に応じほぼ次の錠数になる。本剤は1錠に3本の割線があり、プラジカンテル150mgを含有する4個の錠片に分割することができ、投与量を患者の体重に応じて調整することができるので、できるだけ正確な用量を投与すること。

| 体重(kg) | 錠数 | 体重(kg) | 錠数 |
|--------|----------------|--------|----------------|
| 20～26 | $\frac{3}{4}$ | 57～63 | 2 |
| 27～33 | 1 | 64～70 | $2\frac{1}{4}$ |
| 34～41 | $1\frac{1}{4}$ | 71～78 | $2\frac{1}{2}$ |
| 42～48 | $1\frac{1}{2}$ | 79～86 | $2\frac{3}{4}$ |
| 49～56 | $1\frac{3}{4}$ | | |

7.2 高用量投与(50mg/kg)で、用量の増加率以上に血中濃度が増加したとの報告があるので、用法・用量を厳守すること。

7.3 1日2回投与の場合、昼食後及び夕食後に投与することが望ましい。投与間隔は少なくとも4時間以上とすること。

8. 重要な基本的注意

眠気があらわれることがあるので、自動車の運転、機械の操作等危険を伴う作業に注意させること。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 不整脈のある患者

不整脈を助長することがある。

9.2 腎機能障害患者

本剤の排泄が遅延する可能性がある。

9.3 肝機能障害患者

本剤の代謝が低下し、血中濃度が高くなる可能性がある。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。

9.6 授乳婦

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。

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

10. 相互作用

本剤は主にチトクロームP4503A4(CYP3A4)によって代謝される。

10.1 併用禁忌(併用しないこと)

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|------------------------|------------------------------|--|
| リファンピシン(リファジン)[2.3 参照] | 本剤の血中濃度が約100%低下することが報告されている。 | リファンピシンにより代謝酵素(CYP3A4)が誘導され、本剤の代謝が促進されるためと考えられている。 |

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 |
|------------------------------|--|--|
| デキサメタゾン フェニトイン カルバマゼピン | 本剤の血中濃度が低下することが報告されている。 | これらの薬剤が代謝酵素(CYP3A4)を誘導し、本剤のクリアランスを上昇させるためと考えられている。 |
| * エファビレンツ | 本剤の血中濃度が約75%低下することが報告されている。本剤の効果が減弱するおそれがあるので併用を避けることが望ましい。 | エファビレンツが代謝酵素(CYP3A4)を誘導し、本剤のクリアランスを上昇させるためと考えられている。 |
| ヒドロキシクロロキン硫酸塩 | クロロキン(国内未発売)との併用により、本剤の血中濃度が低下することが報告されている。クロロキンと類似の構造を有するヒドロキシクロロキン硫酸塩との併用においても同様に本剤の血中濃度が低下する可能性がある。 | 発現機序の詳細は不明である。 |
| * シメチジン リトナビル | 本剤の血中濃度が上昇することが報告されている。 | これらの薬剤が代謝酵素(CYP3A4)を阻害し、本剤のクリアランスを低下させるためと考えられている。 |
| イトラコナゾール | 本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。ケトコナゾール(経口剤：国内未発売)との併用により、本剤の血中濃度が上昇することが報告されている。 | イトラコナゾールが代謝酵素(CYP3A4)を阻害し、本剤のクリアランスを低下させるためと考えられている。 |

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。

11.2 その他の副作用

| | 5%以上 | 5%未満 | 頻度不明 |
|-----|-------------------------|------------------------------------|----------------------|
| 過敏症 | | 発疹 | アレルギー反応(多発性漿膜炎等)、そう痒 |
| 肝臓 | γ -GTP上昇 | AST上昇、ALT上昇、LDH上昇、Al-P上昇、血清ビリルビン上昇 | |
| 血液 | 赤血球減少、血小板減少、好酸球増多、白血球増加 | | |
| 消化器 | 嘔気・嘔吐 | 腹痛、食欲不振、下痢 | |

| | 5%以上 | 5%未満 | 頻度不明 |
|-------|--------|--------|------------------|
| 精神神経系 | 頭痛・頭重感 | 眠気、めまい | 痙攣、眩暈、脳波の徐波増加 |
| その他 | 倦怠感 | 発熱 | 無力症(脱力感)、筋肉痛、不整脈 |

15. その他の注意

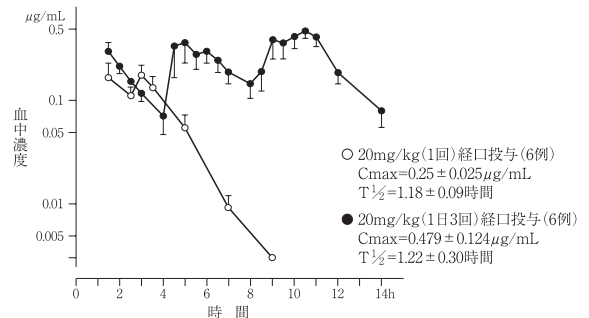
15.1 臨床使用に基づく情報

成虫の住血吸虫と比較し、幼虫の住血吸虫は本剤に対する感受性が低いとの報告があり¹⁾、幼虫ステージでは、十分な効果が得られないことがある(最新の寄生虫薬物治療の手引き等を参照すること)。また本剤の投与により、住血吸虫の抗原に対する炎症性の免疫応答と思われる重篤な事象(呼吸不全、脳症、脳血管炎等)があらわれるとの報告がある²⁻⁴⁾。住血吸虫症に対する本剤の有用性は外国においては確立されており、WHOでは住血吸虫症の治療のエッセンシャル・ドラッグとされているが、国内における評価症例がないため、我国においては住血吸虫症に対する効能は承認されていない。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人に20mg/kgを1回又は1日3回^{注)}経口投与した場合、血中濃度は図のとおりである⁵⁾(外国人データ)。



16.3 分布

ラットに¹⁴C-プラジカンテルを1回10mg/kgを経口投与した実験では、肝、腎、副腎、卵巣及び子宮へ高い移行が認められる。その他の臓器では血中放射能濃度と同程度又はそれ以下である⁶⁾。

16.4 代謝

健康成人に¹⁴C-プラジカンテルを1回14mg/kg及び46mg/kg^{注)}を経口投与した場合、代謝は非常に速やかで、ほぼ完全に代謝される。尿中には未変化体はほとんど認められない。血中主代謝物は一水酸化体、尿中主代謝物は二水酸化体である⁷⁾(外国人データ)。

16.5 排泄

健康成人に¹⁴C-プラジカンテルを1回14mg/kg及び46mg/kg^{注)}を経口投与した場合、尿中排泄率はそれぞれ84%、80%であり、いずれも24時間までにその90%以上が排泄される⁸⁾(外国人データ)。

注)本剤の承認用量は1回20mg/kg1日1~2回である。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 一般臨床試験

厚生省「輸入熱帯病の薬物治療法に関する研究班」が症例記録を入手できた日本人症例42例の有効性及び安全性を評価した。肝吸虫症には本剤20mg/kgを1日2回2日間、肺吸虫症には本剤25mg/kgを1日3回2日間^{注)}又は1日量として25~50mg/kgの2~3

日間⁹⁾、横川吸虫症には本剤20～25mg/kgを1日1～3回1日¹⁰⁾投与した。研究班が評価した有効性は下表のとおりであった⁹⁾。

| 診断名 | 有効率 |
|-------|--------------|
| 肝吸虫症 | 100% (32/32) |
| 肺吸虫症 | 100% (6/6) |
| 横川吸虫症 | 100% (4/4) |
| 計 | 100% (42/42) |

副作用は42例中13例(31.0%)に認められ、主な副作用は発疹3例(7.1%)、下痢3例(7.1%)等であった。

17.1.2 集団治療試験

集団検診で肝吸虫卵が確認された65例(うち61例は横川吸虫卵も確認)を対象に、体重40～49kgの患者には本剤3000mgを、50～59kgの患者には本剤3750mgを、60～75kgの患者には本剤4500mgを3回に分けて1日¹¹⁾投与し、本剤の有効性及び安全性を評価した。

本剤投与後1、2、及び3ヵ月の3回検便を行い一度も虫卵を検出しなかったものを治癒と判定した。治癒率は下表のとおりであった。

| 診断名 | 治癒率 |
|------------|---------------|
| 肝吸虫症 | 81.5% (53/65) |
| 横川吸虫症(合併例) | 94.8% (55/58) |

副作用は65例中25例(38.5%)に認められ、主な副作用は頭痛14例(21.5%)、倦怠感11例(16.9%)、嘔気9例(13.8%)等であった¹⁰⁾。

注)本剤の承認用量は1回20mg/kg1日1～2回である。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

本剤は速やかに吸虫体に取り込まれ、外皮膜リン脂質との相互作用により吸虫の膜構造を不安定化し、吸虫へのCa⁺⁺の流入を促進する。吸虫体内に流入したCa⁺⁺は吸虫の筋収縮及び吸虫外皮の構造的損傷(空胞化等)を惹起し吸虫を致死させる(*in vitro*)¹¹⁾。

18.2 抗肝吸虫作用、抗肺吸虫作用

肝吸虫を実験的に感染させたラット及びウサギ、肺吸虫に実験的に感染させたイヌに本剤を経口投与した場合、虫体回収率、糞便中虫卵数の著しい減少が認められている¹²⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：プラジカンテル(Praziquantel)

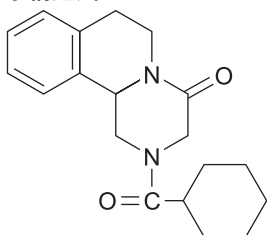
化学名：(±)-2-(Cyclohexylcarbonyl)-1,2,3,6,7,11b-hexahydro-4H-pyrazino[2,1-a]isoquinolin-4-one

分子式：C₁₉H₂₄N₂O₂

分子量：312.41

性状：本品は白色～ほとんど白色の結晶性の粉末である。

化学構造式：



22. 包装

6錠[瓶、バラ]

23. 主要文献

- 1) Grandière-Pérez L, et al.: Am J Trop Med Hyg. 2006; 74: 814-818
- 2) Azher M, et al.: Chest. 1990; 98: 241-243
- 3) Houdon L, et al.: J Travel Med. 2010; 17: 274-277
- 4) Jauréguiberry S, et al.: Am J Trop Med Hyg. 2007; 76: 964-966
- 5) Leopold G, et al.: Eur J Clin Pharmacol. 1978; 14: 281-291
- 6) Steiner K, et al.: Eur J Drug Metab Pharmacokinet. 1976; 1: 85-95
- 7) Bühring KU, et al.: Eur J Drug Metab Pharmacokinet. 1978; 3: 179-190
- 8) Patzschke K, et al.: Eur J Drug Metab Pharmacokinet. 1979; 4: 149-156
- 9) 田辺清勝他: 基礎と臨床. 1986; 20: 8309-8315
- 10) 横川宗雄他: 寄生虫学雑誌. 1986; 35: 165-170
- 11) Mehlhorn H, et al.: Arzneimittel-Forsch. 1983; 33(I): 91-98
- 12) 社内資料: 薬効薬理

24. 文献請求先及び問い合わせ先

文献請求先

バイエル薬品株式会社・メディカルインフォメーション
〒530-0001大阪市北区梅田二丁目4番9号
バイエル医療用医薬品のお問い合わせ先
電話0120-106-398

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

バイエル薬品株式会社
大阪市北区梅田二丁目4番9号