

貯法：室温、気密容器に保存
使用期限：外箱に表示



Biltricide[®]

D4

DL

■ 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- (1)本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (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.]
- (3)リファンピシンを投与中の患者[「相互作用」の項参照]

■ 組成・性状

販売名	ビルトリシド錠600mg
成分・含量	1錠中、プラジカンテル600mg含有
添加物	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
色・剤形	白色～橙色を帯びた白色の長円形のフィルムコーティング錠(割線あり)
外形(識別コード)	
長径(mm)	22.2
短径(mm)	8.2
厚さ(mm)	6.4
重さ(mg)	912.0

■ 効能・効果

肝吸虫症、肺吸虫症、横川吸虫症

*** 効能・効果に関連する使用上の注意**

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。[「その他の注意」の項参照]

■ 用法・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。

用法・用量に関連する使用上の注意

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。

体重(kg)	錠数	体重(kg)	錠数
20～26	¾	57～63	2
27～33	1	64～70	2¼
34～41	1¼	71～78	2½
42～48	1½	79～86	2¾
49～56	1¾		

■ 使用上の注意

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1)腎機能障害のある患者[本剤の排泄が遅延する可能性がある。(「薬物動態」の項参照)]
- (2)肝機能障害のある患者[本剤の代謝が低下し、血中濃度が高くなる可能性がある。(「薬物動態」の項参照)]
- (3)不整脈のある患者[不整脈を助長することがある.]

2. 重要な基本的注意

- (1)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。
- (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。
- (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。
- (4)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。

3. 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。

(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 リファジン等	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。

※(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。
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	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。	

4. 副作用

承認時及び使用成績調査での調査症例699例中129例(18.45%)に副作用(臨床検査値の異常変動を含む)が認められ、主な副作用は嘔気20件(2.86%)、下痢17件(2.43%)、頭痛15件(2.15%)、腹痛14件(2.00%)等であった。(再審査終了時)

	0.1～5%未満	0.1%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)、痒痒
肝臓	AST(GOT)上昇, ALT(GPT)上昇, γ-GTP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		
精神神経系	頭痛・頭重感, 眠 気, めまい	脳波の徐波増加	痙攣, 眩暈

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明*
その他	倦怠感, 発熱		無力症(脱力感), 筋肉痛, 不整脈

※自発報告又は海外のみで認められている副作用については頻度不明とした。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため、慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2)授乳中の婦人には投与当日及びその後72時間は授乳を中止させること。[ヒト母乳中へ移行することがある。]

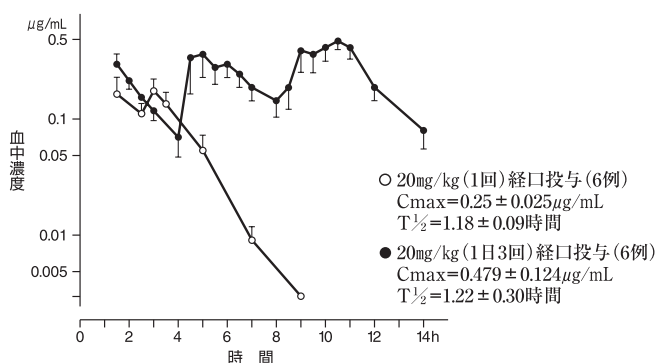
*7. その他の注意

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(最新の寄生虫症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⁾。

■ 薬物動態

血中濃度

健康成人に20mg/kgを1回又は1日3回経口投与した場合、血中濃度は図のとおりである⁵⁾。(参考：外国人)



(注：本剤の承認用量は1回20mg/kg 1日1～2回である。)

代謝

健康成人に¹⁴C-プラジカンテルを1回14mg/kg及び46mg/kg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⁶⁾。(参考：外国人)

(注：本剤の承認用量は1回20mg/kg 1日1～2回である。)

排泄

健康成人に¹⁴C-プラジカンテルを1回14mg/kg及び46mg/kg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⁷⁾。(参考：外国人)

(注：本剤の承認用量は1回20mg/kg 1日1～2回である。)

〈参考〉

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⁸⁾。

■ 臨床成績

総計107例について実施された臨床試験の概要は次のとおりである^{9,10)}。

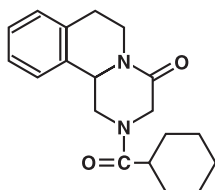
効能・効果	有効率
肝吸虫症 〔横川吸虫症の合併症58例の場合〕	87.6% (85/97) 〔94.8% (55/58)〕
肺吸虫症	100% (6/ 6)
横川吸虫症	100% (4/ 4)
合 計	88.8% (95/107)

■ 薬効薬理

1. 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⁾。
2. 実験的感染動物(肝吸虫, 肺吸虫)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⁾。

■ 有効成分に関する理化学的知見

構造式:



一般名: プラジカンテル (Praziquantel) JAN
(Praziquantel INN)

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。

■ 包 装

錠剤600mg バラ包装 6錠

■ 主要文献

- * 1) Grandière-Pérez, L. et al.: *Am. J. Trop. Med. Hyg.*, **74**, 814 (2006)
- * 2) Azher, M. et al.: *Chest*, **98**, 241 (1990)
- * 3) Houdon, L. et al.: *J. Travel Med.*, **17**, 274 (2010)
- * 4) Jauréguiberry, S. et al.: *Am. J. Trop. Med. Hyg.*, **76**, 964 (2007)
- 5) Leopold, G. et al.: *Eur. J. Clin. Pharmacol.*, **14**, 281 (1978)
- 6) Bühring, K. U. et al.: *Eur. J. Drug Metab. Pharmacokinet.*, **3**, 179 (1978)
- 7) Patzschke, K. et al.: *Eur. J. Drug Metab. Pharmacokinet.*, **3**, 149 (1979)
- 8) Steiner, K. et al.: *Eur. J. Drug Metab. Pharmacokinet.*, **2**, 97 (1976)
- 9) 田辺清勝他: 基礎と臨床, **20**(16), 191 (1986)
- 10) 横川宗雄他: 寄生虫学雑誌, **35**(3), 165 (1986)
- 11) Mehlhorn, H. et al.: *Arzneim.-Forsch.*, **33**(I), Nr.1, 91 (1983)
- 12) Andrews, P. et al.: バイエル薬品社内資料[薬効薬理] (1978)

■ 文献請求先

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

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

バイエル薬品株式会社・くすり相談 ☎0120-106-398

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