

BILASTINA

García Palomo M., Rubio Salvador A. R. Servicio de Farmacia del Hospital Virgen de la Salud de Toledo.

Bilastina es un antihistamínico oral no sedante de segunda generación, indicado para la rinoconjuntivitis alérgica y la urticaria. Ha demostrado ser tan eficaz como otros antihistamínicos, con un perfil de seguridad similar aunque con mayor riesgo de interacciones.

INDICACIONES

Bilastina está indicado para el tratamiento sintomático de la rinoconjuntivitis alérgica estacional y perenne y de la urticaria¹.

POSOLOGÍA Y FORMA DE ADMINISTRACIÓN

La dosis recomendada es de 20 mg/día en dosis única diaria una hora antes o dos horas después de las comidas¹.

No se recomienda en menores de 12 años. No es necesario ajustar la dosis en pacientes ancianos o con insuficiencia renal o hepática¹.

MECANISMO DE ACCIÓN Y FARMACOCINÉTICA

Bilastina es un antagonista de la histamina no sedante y de acción prolongada, con afinidad antagonista selectiva por los receptores H1 periféricos y sin afinidad por los receptores muscarínicos¹.

Tiene una biodisponibilidad oral del 61%, y tarda en alcanzar la concentración plasmática máxima 1,3 horas. Se une a proteínas plasmáticas entre un 84-90% y no se metaboliza por vía hepática ni tampoco inhibe enzimas del CYP3A4, sino que es sustrato de la glicoproteína P. Se elimina prácticamente inalterada en orina y en heces, con una vida media de eliminación de 14,5 horas. Presenta farmacocinética lineal con baja variabilidad interindividual¹.

EFICACIA CLÍNICA

- **Rinitis alérgica estacional.** Se han publicado dos ensayos clínicos aleatorizados doble ciego, frente a placebo y cetirizina² y frente a placebo y desloratadina³, incluyendo a pacientes adultos de 12 a 70 años diagnosticados de rinitis alérgica estacional de al menos dos años de duración. La duración de ambos ensayos fue de 14 días y se incluyeron a 683 y 721 pacientes, respectivamente. La variable principal de eficacia en ambos ensayos fue el área bajo la curva (AUC) de la puntuación total de los síntomas nasales (congestión, rinorrea, estornudos, picor) y no nasales (picor ocular, lagrimeo y enrojecimiento) registrados por el paciente, dos veces al día (mañana y noche) en las 12 horas previas, desde el inicio (día 0) hasta el final del tratamiento (día 14). En el primer ensayo la disminución del AUC producida por bilastina fue similar a la producida por cetirizina pero significativamente superior a la producida por placebo². Lo mismo ocurrió en el segundo ensayo en el que no se obtuvieron diferencias significativas en la disminución del AUC entre desloratadina y bilastina, aunque sí entre bilastina y placebo³.

- **Rinitis alérgica perenne.** En un ensayo clínico multicéntrico, randomizado, controlado con placebo, doble ciego, en 650 pacientes⁴ se comparó bilastina 20 mg frente a cetirizina 10 mg y placebo, una vez al día durante 28 días. La variable principal de eficacia fue el AUC de la puntuación total de 6 síntomas (nasales y no nasales) desde el día 1 hasta el 28. En la población total no hubo diferencias estadísticamente significativas entre los

tratamientos activos y placebo, aunque si se excluían los pacientes sudafricanos, que habían tenido una extraordinaria respuesta a placebo, sí que se demostraban. Las diferencias entre las poblaciones de estudio (sudafricanos frente a argentinos y europeos) en los síntomas basales y las características antropométricas de los pacientes es lo que podría haber ocasionado el no encontrar diferencias cuando se evaluaban los datos en el total de la población⁵.

- **Urticaria idiopática crónica.** Se ha publicado un ensayo clínico multicéntrico, randomizado, controlado con placebo y doble ciego en 525 pacientes comparando bilastina 20 mg frente a levocetirizina 5 mg y placebo, administrados una vez al día durante 28 días. La variable principal evaluada fue el cambio de tres síntomas (prurito, número de habones y diámetro de los mismos) desde la situación basal hasta el día 28, según la valoración del paciente. Se produjo una reducción de los síntomas de prurito y número de habones similar y no significativa entre bilastina y levocetirizina, aunque sí fue significativamente superior la de bilastina frente a placebo. Sin embargo, el diámetro máximo de los habones fue reducido significativamente y de un modo superior en el grupo tratado con levocetirizina frente al grupo tratado con bilastina⁶.

SEGURIDAD

Los efectos adversos más frecuentes observados con bilastina (1-10%) son cefalea, somnolencia y fatiga^{1,2,3,6}.

Otros trastornos notificados con menor frecuencia son: herpes labial, aumento del apetito, insomnio, ansiedad, tinnitus, vértigo, trastornos cardíacos, mareo, disnea, molestias nasales, sequedad nasal, trastornos gastrointestinales, prurito, fatiga, sed, pirexia, astenia, aumento de transaminasas y de peso, de creatinina plasmáticas y de triglicéridos¹.

En cuanto a la capacidad de conducción, no parece verse alterada con dosis de bilastina de incluso hasta 40 mg/día cuando se compara con hidroxicina⁷ o con levocetirizina⁸.

Tampoco presenta efectos adversos psicomotores ni cardiotoxicos. Los efectos sobre el sistema nervioso central no se producen a dosis terapéuticas, aunque sí a dosis altas (80 mg)⁹.

En general, la tolerancia de bilastina parece ser similar a la de otros antihistamínicos de segunda generación usados como comparadores en los ensayos clínicos (cetirizina², desloratadina³ y levocetirizina⁶) en cuanto a la incidencia global de efectos adversos, efectos adversos relacionados con el tratamiento y efectos adversos graves⁵.

INTERACCIONES

- Interacciones con alimentos: los alimentos y los zumos de pomelo y otras frutas reducen significativamente la biodisponibilidad de bilastina hasta un 30%^{1,5}.

- Interacción con sustratos o inhibidores de la enzima

OATP12 (ritonavir, rifampicina): pueden reducir la concentración plasmática de bilastina¹.

- Inhibidores de la glicoproteína P (ketoconazol, eritromicina, ciclosporina, diltiazem, ritonavir): en situación de insuficiencia renal moderada o grave pueden aumentar los niveles plasmáticos de bilastina y por tanto el riesgo de efectos adversos¹.

- Diltiazem: aumentó las concentraciones plasmáticas de bilastina en un 50% pero sin afectarse el perfil de seguridad¹.

- Alcohol: no parece disminuir el rendimiento psicomotor al administrarlo conjuntamente con bilastina¹.

LUGAR EN TERAPÉUTICA

Bilastina es un antihistamínico oral no sedante, autorizado para el tratamiento de la rinoconjuntivitis alérgica y de la urticaria, con eficacia similar a otros antihistamínicos en el alivio de los síntomas de la rinitis alérgica, y similar o inferior en el tratamiento de la urticaria.

Su perfil de seguridad es también similar al de los antihistamínicos frente a los que se ha comparado (somnolencia, cefalea y fatiga), aunque presenta más interacciones medicamentosas y, a diferencia de otros, no puede administrarse con las comidas o con zumos de frutas ya que se reduce significativamente su absorción.

No supone un avance terapéutico en el tratamiento de la

rinitis alérgica ni de la urticaria frente a los antihistamínicos a los que se ha comparado. Además, presenta una pauta más incómoda y un coste económico superior al de otros comercializados con anterioridad.

En el tratamiento sintomático de la rinoconjuntivitis y de la urticaria se recomienda seguir utilizando los antihistamínicos con mayor experiencia de uso y menor coste, como la loratadina y la cetirizina.

CONCLUSIONES

1. Bilastina es un nuevo antihistamínico autorizado para el tratamiento sintomático de la rinoconjuntivitis alérgica y la urticaria.
2. En los ensayos clínicos publicados ha demostrado ser similar a desloratadina y a cetirizina en el tratamiento de la rinoconjuntivitis alérgica.
3. En la urticaria, ha sido similar a levocetirizina en la disminución del prurito, pero menos eficaz en disminuir el tamaño de los habones.
4. Es un fármaco seguro y bien tolerado, aunque tiene una pauta de administración más incómoda que la de otros antihistamínicos al tener que administrarse con el estómago vacío para evitar las interacciones con comidas y con zumos de frutas.
5. Presenta igual eficacia y seguridad pero con coste superior a otros antihistamínicos de 2ª generación.

Presentaciones: Bilaxten®, Obalix®, Ibis® 20 mg 20 comprimidos (12,80 €).

Grupo terapéutico: R06AX. Otros antihistamínicos uso sistémico.

Condiciones de dispensación: Receta médica.

COSTE TRATAMIENTO/DÍA COMPARATIVO

Bilastina 20 mg/24 h.	0,64 €
Cetirizina 10 mg/24 h.	0,16 €
Loratadina 10 mg/24 h.	0,16 €
Fexofenadina 120 mg/24 h.	0,18 €
Ebastina 10 mg/24 h.	0,22 €
Levocetirizina 5 mg/24 h.	0,30 €
Desloratadina 5 mg/24 h.	0,34 €
Rupatadina 10 mg/24 h.	0,58 €

Fuente: Nomenclátor de Facturación julio 2013.

BIBLIOGRAFÍA

1. Ficha técnica IBIS®. Disponible en: www.aemps.es. Acceso: 17 de mayo de 2013.
2. Kuna P. et al. Efficacy and safety of bilastine 20 mg compared with cetirizine 10 mg and placebo for the symptomatic treatment of seasonal allergic rhinitis: a randomized, double-blind, parallel-group study. *Clinical and Experimental Allergy* 2009; 39: 1338-47.
3. Bachert C. et al. Comparison of the efficacy and safety of bilastine 20 mg versus desloratadine 5 mg in seasonal allergic rhinitis patients. *Allergy* 2009; 64: 158-165.
4. Sastre et al. Efficacy and safety of bilastine 20 mg compared with cetirizine 10 mg and placebo in the treatment of perennial allergic rhinitis. *Curr Med Res Opin.* 2012 Jan; 28 (1): 121-30.
5. Carter t al. Bilastine in allergic rhinitis and urticaria. *Drugs* 2012; 72 (9): 1257-1269.
6. Zuberbier T. et al. Comparison of the efficacy and safety of bilastine 20 mg vs levocetirizine 5 mg for the treatment of chronic idiopathic urticaria: a multi-centre, double-blind, randomized, placebo-controlled study. *Allergy* 2010; 65: 516-528.
7. Conen et al. Acute and subchronic effects of bilastine (20 and 40 mg) and hydroxyzine (50 mg) on actual driving performance in healthy volunteers. *Journal of Psychopharmacology* 25 (11) 1517-1523.
8. Jáuregui et al. Bilastine for the treatment of urticaria. *Expert Opinion Pharmacotherapy.* 2013 May 16. [Epub ahead of print].
9. García-Gea C. et al. Comparison of peripheral and central effects of single and repeated oral dose administrations of bilastine, a new H1 antihistamine: a dose-range study in healthy volunteers with hydroxyzine and placebo as control treatments. *J. Clin Psychopharmacol* 2008 Dec; 28 (6): 675-85.

Comité de Redacción:

Arroyo Pineda V, Fernández-Corada Sánchez A, Martín Alcalde E, Martínez Cruz S, Pérez Rodríguez I, Rubio Salvador AR, Ortiz Martín T, Sánchez de la Nieta MD, Tejada Cifuentes F, Alonso Moreno FJ, Flor García A, Rubio Pulido O, Lara Sánchez C, Jiménez de Andrés E.

Consejo Editorial:

Área de Farmacia, Comisiones de Farmacia y Terapéutica y del Uso Racional del Medicamento de las Gerencias de Área Integrada y de las Gerencias de Atención Especializada y Primaria de Albacete y Toledo. SESCAM.



Edita SESCAM - Área de Farmacia

Dirección de correo: Eduardo Jiménez de Andrés. Secretaría Comité de Redacción. Área de Farmacia SESCAM.

Avenida Río Guadiana, 4. Toledo 45071. Teléfono: 925/27.41.00 Fax: 925/27.41.44 E-mail: burm@sescam.jccm.es

I.S.S.N.: 1576-2416

D.L.: TO-603-2012