

コンパス薬局横浜西 スキルアップ勉強会

2016.12.6 味田村

第110回 『デザレックス錠』

杏林製薬株式会社 松田 美桜 様

参加者：味田村 根井 加納 渡辺 吉岡 畠山

デスロラタジンはヒスタミン H1 受容体に選択的に結合する化合物であり、広く使用されている第二世代抗ヒスタミン薬であるロラタジンの主要活性代謝物として見出された。

非鎮静性で長時間作用型の第二世代抗ヒスタミン薬であるデスロラタジンは、2016年8月現在、米国、欧州をはじめとする120以上の国や地域で、通年性及び季節性アレルギー性鼻炎、慢性特発性蕁麻疹の症状緩和を適応として承認されている。

本邦の臨床開発は2012年から開始され、デスロラタジンが日本人患者においてもアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒に対する有効性、安全性及び忍容性を有することが確認され、2016年9月に「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」を効能・効果として承認された。

【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

【用法用量】

通常、12歳以上の小児及び成人にはデスロラタジンとして1回5mgを1日1回経口投与する。

【特徴】

ロラタジンはプロドラック製剤であり、生体内でCYP3A4とCYP2D6により活性代謝物であるデスロラタジンとして抗ヒスタミン作用を発揮する。しかしCYP2D6は代謝能低下が日本人では55%に認められており十分な効果が発揮できないという問題があった。デザレックスはロラタジンの活性代謝物であるデスロラタジン自体を主成分とするため、代謝による人種や個人差の影響がなく、強力な抗ヒスタミン作用が期待できる製剤である。

花粉症患者を対象にフェキソフェナジン180mg（国内容量120mg）とデザレックス5mgを比較した海外臨床試験では同等の効果が認められたことから、国内用量ではフェキソフェナジンの1.5倍の抗ヒスタミン効果が期待できる製剤である。

【副作用】

アレルギー性鼻炎及び慢性蕁麻疹を対象とした国内第Ⅲ相試験において、505 例中 20 例（4.0%）に副作用が認められた。主な副作用は、傾眠 5 例（1.0%）、白血球数増加 3 例（0.6%）、血中コレステロール増加 2 例（0.4%）であった。（承認時）

【考察】

デザレックスは効果が強いだけでなく、眠気に関しても副作用発生率は 1%と低くプラセボと同程度のため運転などの注意喚起の記載はない。海外ではパイロットも服用可能な薬剤として使用されており、アルコール併用下においてもインペアード・パフォーマンスに影響がないため受験生やアルコール摂取の多い患者にも選択しやすい薬剤である。また食事の影響がなく半減期が第二世代抗ヒスタミン薬の中で最も長いことから服薬のタイミングも個人に合わせて選択しやすいという点も有益である。

デザレックスはロラタジンの活性代謝物であるため、ロラタジンに過敏症の既往歴や副作用歴がある場合には注意が必要である。

抗ヒスタミン薬は効果・副作用に個人差があるため、効果の強く眠気の少ないデザレックスの発売で選択肢が増えることは治療にとって非常に有益である。

【質問事項】

Q1. 用法・用量に適宜増減はないが、増量・減量は可能か？

A1. 現在のところ承認容量は 5 mg のみの為、増量・減量は保険審査上はねられる可能性がある。

Q2. 小児の適応は今後取得する予定はあるか？

A2. 現在のところ開発の予定はない。

アメリカでは 6 ヶ月以上から、欧州では 1 歳以上から適応を取得している。

Q3. 一包化や粉砕は可能か？

A3. 一包化に関しては、光暴露試験において 5 2 週で類縁物質の増加が認められたことから推奨していない。短期の安定性試験データが無いため推奨していない。

粉砕に関しては強い苦味が出るため推奨していない。