

第 123 回 『ルパフィン錠』

田辺三菱製薬株式会社 酒井様

参加者：小野田先生、佐藤、高柳、渡辺、吉岡、小平、高橋、山城、野田、小西

アレルギー性疾患に対する治療薬は、H1 受容体拮抗薬、ロイコトリエン受容体拮抗薬、ケミカルメディエーター遊離抑制薬、トロンボキサン A2 受容体拮抗薬など異なる作用機序のものが使用されている。その中でも最近では眠気が少ない 1 日 1 回タイプの第二世代 H1 受容体拮抗薬が多く使用されている。ルパタジンは H1 受容体拮抗作用の他、血小板活性化因子 (PAF) の受容体拮抗作用をもつ新しい作用機序の薬である。PAF とは血管拡張、血管透過性の更新、知覚神経刺激などを誘導するケミカルメディエーターであり、くしゃみや鼻水などを引き起こす。ルパタジンはこの PAF を阻害することでも、アレルギー症状を緩和する。

【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ルパタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、症状に応じて、ルパタジンとして 1 回 20mg に増量できる。

【特徴】

- ・今までの抗アレルギー薬にはなかった PAF に対する作用で、症状を緩和する(ルチジニル構造によるもの)
- ・肝代謝型薬剤であり、CYP 3A4 で代謝される
- ・ルパタジン本体も抗アレルギー作用をもち、主な代謝産物であるデスロラタジンも抗アレルギー作用を示す
- ・食事の影響を受けないため、1 日 1 回いつでも服用が可能
- ・効果発現が早く、長時間効く

【副作用】

国内臨床試験においては 1059 例中、副作用（臨床検査値異常変動を含む）は 135 例（12.7%）であった。主なものは、眠気 98 例（9.3%）、口渇 7 例（0.7%）、倦怠感 6 例（0.6%）等であった。重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、てんかん、

痙攣、肝機能障害、黄疸が生じたとの報告あり。

#### 【考察】

今までの抗アレルギー剤はH1受容体拮抗作用によるものが主であったが、それにプラスして PAF に対する作用も有することより、今までの薬よりもより大きな効果を期待できる。ルパタジン本体も薬効を示し、その主な代謝産物であるデスロラタジンも薬効を示すというユニークな作用も魅力的である。食事による影響もなく、服用時間帯も制限がない。即効性もあり、長時間作用するという点では理想的である。あえて欠点をあげるとすれば、危険な作業は避けさせることとの注意書きがあるので、投薬時には注意が必要。また、これから花粉シーズンが到来するが、新薬のため14日制限があるので、忙しくてなかなか受診できないような患者様には使いづらさがある。薬価もそこまで高いわけではないので、1年後投与日数制限が解除されてからが、本来の実力を発揮するものと思われる。

#### 【質疑応答】

Q:鼻炎、蕁麻疹、かゆみなどに効くが、その中でも特にどれに効くというデータはあるか？

→どの症状に特に特異的に効くかといったデータはない。

Q:ルパフィンが代謝されてデスロラタジンになるということは、すでに市販されているデスロラタジンよりもルパフィンの方が薬効的に勝るといった認識で間違えないか？

→それで間違えない。