

第2世代抗ヒスタミン薬 フォーミュラリ Ver. 1.0

2025. 10. 7 作成

推奨	推 奨					
一般名	フェキソフェナジン塩酸塩		オロパタジン塩酸塩		レボセチリジン塩酸塩	
代表的な 製品名	(GE) フェキソフェナ ジン塩酸塩錠	(先発) アレグラ®錠	(GE) オロパタジン 塩酸塩錠	(先発) アレロック®錠	(GE) レボセチリジン 塩酸塩錠	(先発) ザイザル®錠
標準的 1日薬価	20. ⁸ ~46. ² 円 (120mg/日)	52. ² 円 (120mg/日)	20. ⁸ 円 (10mg/日)	41. ⁴ 円 (10mg/日)	12. ³ ~16. ⁴ 円 (5mg/日)	41. ¹ 円 (5mg/日)
効能・効果	○アレルギー性鼻炎 ○蕁麻疹 ○皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、 皮膚掻痒症（ひふそうよう しょう）、アトピー性皮膚 炎）に伴う痒み		○アレルギー性鼻炎 ○蕁麻疹、皮膚疾患に伴う掻痒 （湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚 掻痒症、尋常性乾癬 ^{成人のみ} 、 多形滲出性紅斑 ^{成人のみ} ）		○アレルギー性鼻炎 ○蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、 痒疹、皮膚掻痒症	
用法	1日2回 経口投与		1日2回 朝及び就寝前に経口投与		1日1回 就寝前に経口投与	
用量	1回 60 mg		1回 5 mg		1回 5 mg（最大 10 mg）	
※半減期(hr)	9.6±5.7（60 mg）		8.75 ±4.63（錠、5mg）		7.33±0.98（錠、5mg）	
特徴など	・脳に影響を及ぼしにくい ため、眠くなりにくい ・「集中力、判断力、作業 能率の低下」といった、 気づきにくい能力ダウン （インペアード・パフォー マンス）も起こしにくい。 ・口が渇きにくい。 ・空腹時でも服用可能。 ・6か月以上の小児に適応あ り（ドライシロップのみ）。		・従来の抗ヒスタミン薬に比 べて抗コリン作用が少な く、従来の薬に見られやす い口渇や排尿障害などの副 作用が軽減されているのが 特徴。 ・眠気を催すことがあるの で、本剤投与中の患者には 自動車の運転等危険を伴う 機械の操作には従事させな いよう十分注意すること。 ・2歳以上の小児に適応あ り、ドライシロップ剤、顆 粒剤がある。		・用法が就寝前となっている が、日中の眠気への配慮も 必要と考えられる。 ・6ヶ月以上の小児に適応 あり、ドライシロップ 剤、シロップ剤がある。 ・自動車の運転等危 険を伴 う機械の操作には従事させ ないよう十分注意する。	

※半減期等の詳細については各メーカーにご確認ください。

推奨	オプション
一般名	ビラスチン
代表的な 製品名	(先発) ビラノア®錠
標準的 1日薬価	48. ⁷ 円 (20mg/日)
効能・効果	○アレルギー性鼻炎 ○蕁麻疹 ○皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症）に伴う掻痒
用法	1日1回 空腹時に経口投与
用量	1回 20mg
※半減期(hr)	10.54(錠、20mg)
特徴など	・小児への適応はない。 ・ビラスチンは食事の影響を受けやすく、普通錠 20mg を単回経口投与したとき空腹時に比べ食後投与時の Cmax 及び AUC_{0-t} はそれぞれ約 60%及び約 40%低下したとの報告もある。このことから、空腹時投与となっており利便性は悪い。 ・眠気や倦怠感が少なく重大な副作用も無いことから、推奨薬が副作用で使用できない場合のオプションとして使用する。

※半減期等の詳細については各メーカーにご確認ください。

解 説

有効性・安全性

- ・日本では 2025 年 9 月時点で、15 種類の第 2 世代抗ヒスタミン剤が発売されている。
- ・アレルギー総合ガイドライン 2019¹においては、中枢への影響を考慮し第 2 世代の使用が推奨されているが、第 2 世代間での使い分けについては明記されていない。
- ・海外の第 2 世代抗ヒスタミン薬のアルゴリズムにおいて、アレルギー性鼻炎および蕁麻疹において、ビラスチン、フェキソフェナジンは有効性、安全性で優れていると記載されている²。オロパタジン、ベポタスチンは海外での承認がない。
- ・第 2 世代抗ヒスタミン薬については、鼻アレルギー診療ガイドライン 2020 年版（改訂第 9 版）では 15 種類（合剤除く）と定められている。
- ・近年は眠気への配慮から眠くなりにくい薬剤が選択される傾向がある。抗ヒスタミン剤服用中に本人の自覚の有無にかかわらず、集中力・判断力・作業効率が低下することは、インペアード・パフォーマンスといわれており、薬剤の脳内 H1 受容体占拠率が高いほど、発生しやすいとされる。この占拠率の低い薬剤が望まれる³。

【参照】 ビラスチン 20mg、フェキソフェナジン 60mg・120mg、デスロラタジン 5mg、レボセチリジン 5mg、エピナスチン 20mg、エバスチン 10mg、セチリジン 10mg、ロラタジン 10mg、オロパタジン 5mg 他、少ない順に並べられる。（ルパタジン 10mg 記載なし不明）

- ・この働きは、脳内のヒスタミンがブロックされることで眠気を引き起こす他、認知機能、記憶へのデメリットとして働くとされている。占拠率の高い薬剤では、長期投与についても控えたい⁴。
- ・眠気と効果は関連しないとの報告もある⁵。
- ・禁忌・慎重投与の少ないものを検討した³。
- ・投与回数や用量調整の必要ないものを検討した。（各社添付文書参照）

【参照】

- ◇フェキソフェナジン： 1 回 60mg 1 日 2 回 経口投与
- ◇レボセチリジン： 1 回 5mg(最大：10mg) 1 日 1 回 経口投与(就寝前)
- ◇オロパタジン： 1 回 5mg 1 日 2 回 経口投与(朝、就寝前)
- ◇ビラスチン： 1 回 20mg 1 日 1 回 経口投与(空腹時)
- ・食事による影響について、空腹時、寝る前、の内服指示も多く、効果減弱の度合いは食事の内容が高脂肪食かどうかによって左右されないことから、そのリスク回避のために時間をあけての服用が望まれる。（引用：各社 IF）
- ・妊婦、授乳婦については、一般的に有益投与が検討されるが、本フォーミュラリでは、検討にあたり優先順位は高くない。（引用：各社 IF）

【参照】

妊婦

授乳婦

- | | | |
|------------|-------|-----------------|
| ◇フェキソフェナジン | ：有益投与 | 有益投与（乳汁中移行報告有り） |
| ◇レボセチリジン | ：有益投与 | 有益投与（乳汁中移行報告有り） |
| ◇オロパタジン | ：有益投与 | 有益投与（乳汁中移行報告有り） |
| ◇ビラスチン | ：有益投与 | 有益投与（乳汁中移行報告有り） |

推奨の理由

・有効性・安全性、各薬剤の特徴（上記）、経済性、処方実績を考慮し、推奨薬をオロパタジン、フェキソフェナジン、レボセチリジンとし、オプションをビラスチンとした。

なお、成人の抗アレルギー薬に対するフォーミュラリであることに留意して欲しい。また、抗ヒスタミン剤の有効性には個人差があるため、既存薬で効果が得られている場合にはこの限りではない。

《 推奨薬 》 オロパタジン、フェキソフェナジン、レボセチリジン

フェキソフェナジンは、小児から成人、妊婦、授乳婦での有効性・安全性が高い。

また、添付文書上には自動車運転等の注意喚起の記載が無いので、利便性が高い。

レボセチリジンは用法が就寝前となっているが、日中の眠気への配慮も必要と考える。また、生後6ヶ月以上の小児に適応あり、シロップ剤型がある。オロパタジンは小児から成人、妊婦、授乳婦での有効性・安全性が高い。なお、レボセチリジンやオロパタジンを服用中は自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないよう十分注意する。

推奨薬はいずれの薬剤にも後発医薬品が発売されており経済性に優れていること、剤形が豊富で患者に合った製剤を選択できるメリットがある。

《 オプション 》 ビラスチン

ビラスチンは食事の影響を受けやすく、普通錠 20mg を単回経口投与したとき空腹時に比べ食後投与時のC_{max} 及びAUC_{0-t}はそれぞれ約 60%及び約 40%低下したとの報告もある。このことから、空腹時投与となっており利便性が悪い。一方、眠気や倦怠感が少なく重大な副作用も無いことから、推奨薬が副作用で使用できない場合のオプションとして使用する。

* その他の薬剤：デスロラタジン、ルパタジン

デスロラタジンはロラタジンの活性代謝物であり、有効性はロラタジンとほぼ同様であるが先発医薬品しか発売されておらず薬価が高額であることからフォーミュラリから除外した。

ルパタジンは新しい薬剤だが、眠気(自動車運転等に従事させない)や先発医薬品しか発売されておらず薬価が高額であるデメリットがある。CYP3A4 阻害薬・グレープフルーツとの併用注意などがあり、有効性についても報告が少ないため、フォーミュラリから除外した。一方、即時反応を抑制する効果や遅発性反応への効果が期待されている。

* 第1世代抗ヒスタミン薬

高齢者の安全な薬物療法ガイドライン 2015⁶では「認知機能低下、せん妄のリスク、口腔乾燥、便秘」の理由から可能な限り使用を控えるよう記載されており、本フォーミュラリから除外した。

<参考文献>

- 1：一般社団法人日本アレルギー学会：アレルギー総合ガイドライン 2019, 2019 年 6 月 14 日（第 1 版）
- 2：Marysia Tiongco Recto, et al. Selecting optimal second-generation antihistamines for allergic rhinitis and urticaria in Asia. Clin Mol Allergy. 2017;15:19
- 3：鼻アレルギー診療ガイドライン 2020 年版（改訂第 9 版）
- 4：水上 精神経誌（2009）111 巻 8 号、谷内 日耳鼻 123:196-204, 2020、K. Yanai et al. / Pharmacology & Therapeutics 178 (2017) 148–156
- 5：川島眞 臨床医薬 27(8): 563-573, 2011.
- 6：高齢者の安全な薬物療法ガイドライン 2015

本フォーミュラリは 2025 年 9 月時点の添付文書・インタビューフォーム・薬価ならびに各種ガイドラインを参考に作成していることに留意されたい。