

花粉症などのアレルギー性鼻炎に使われる薬には飲み薬、舌下薬、点眼薬、点鼻薬、外用薬、注射薬などいろいろあります。

アレルギーの症状は、体の中で「ヒスタミン」や「ロイコトリエン」といった化学物質が作られ、それが鼻や眼、皮膚などに作用することで出現します。

主にヒスタミンはくしゃみや鼻水を引き起こし、ロイコトリエンは鼻づまりを引き起こします。

それぞれに効く薬も違うため、複数の薬を組み合わせることがあります。

今回は頻繁に使用される飲み薬である「抗ヒスタミン薬」についての効果と鎮静作用についての話題です。

ヒスタミンは、「H1 受容体」に結合することで作用を起こします。H1 受容体は鼻や眼、皮膚などの他、脳にも存在し、脳においては覚醒や興奮を司っています。

抗ヒスタミン薬は、ヒスタミンと H1 受容体の結合を抑えることで鼻や眼、皮膚においてはアレルギー症状を抑えますが、脳で作用すると覚醒や興奮を抑えるため眠気や集中力低下（鎮静）の副作用を引き起こします。

そのため脳に移行しやすい抗ヒスタミン薬は鎮静作用が強く、移行しにくい物は鎮静作用が弱いという傾向があります。眠くなくても集中力が低下している、ということもあるため注意が必要です。

脳の H1 受容体の

- 50%以上に作用するものを「鎮静性」、
- 20～50%程度に作用するものを「軽度鎮静性」、
- 20%未満にしか作用しないものを「非鎮静性」

と分類します。

抗ヒスタミン薬の内服薬を脳内 H1 受容体占拠率の高い順から並べたものがこちらです。

() 内は代表的な先発品

鎮静性	クレマスチン (タベジール) はデータなし、20-70%の占拠率と考えられる ケトチフェン (ザジテン) 1mg、ヒドロキシジン (アタラックス) 30mg、ジフェンヒドラミン (レスタミン) 30mg、 オキサトミド (セルテクト) 30mg、クロルフェニラミン (ボララミン) 2mg
軽度鎮静性	メキタジン (ゼスラン、ニボラジン) 3mg、アゼラスチン (アゼプチン) 1mg
非鎮静性	ベボタスチン (タリオン) 10mg、オロパタジン (アレロック) 5mg、ロラタジン (クラリチン) 10mg、 ルパタジン (ルパフィン) データなしだがロラタジンと同程度と考えられる、セチリジン (ジルテック) 10mg、 エバスチン (エバステル) 10mg、エピナスチン (アレジオン) 20mg、レボセチリジン (サイザル) 5mg、 デスロラタジン (デザレックス) 5mg、フェキソフェナジン (アレグラ) 120mg、 フェキソフェナジン (アレグラ) 60mg、ピラスチン (ピラノア) 20mg

鼻アレルギー診療ガイドライン 2020 年版 (改定第 9 版) のデータを元に作成

「非鎮静性」の中でも

フェキソフェナジン（アレグラ）、ロラタジン（クラリチン）、デスロラタジン（デザレックス、ピラスチン（ピラノア）

の4種は特に脳へ移行しにくく、添付文書でも服用後の自動車運転が制限されていません。

一方抗ヒスタミン薬の強さについてですが、

スギ花粉症に対する効果に関しては、それぞれの薬剤を直接比較したデータは少なく、ガイドラインでも「抗ヒスタミン薬」とまとめて記載されており、明確な優劣はないと考えるのが妥当でしょう。

鎮静の強さ、食事との関係、1日の服用回数、錠剤の大きさ、肝機能や腎機能障害の有無、妊娠や授乳の有無などによって薬を選ぶ必要があります。