

年々増加する花粉症・・・

# アレルギー性鼻炎のセルフメディケーション

田辺ファーマ株式会社  
経営戦略本部 ヘルスケア事業部



はじめに

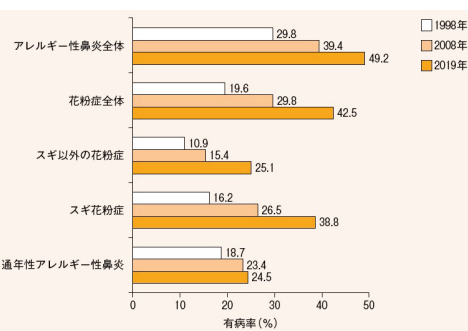
1. アレルギー性鼻炎の疫学
2. 市場調査
3. 花粉症発症のメカニズム
4. ガイドラインに基づくセルフメディケーション
5. 抗ヒスタミン薬
6. タリオンARのご紹介

2 | 田辺ファーマ

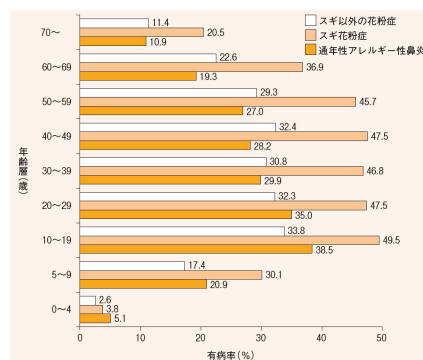
## 1. アレルギー性鼻炎の疫学

- アレルギー性鼻炎は年々増加している
- 10代から50代のほぼ半数の方がスギ花粉症という結果(参考:ガイドライン)

年別有病率



年代別有病率(2019年)

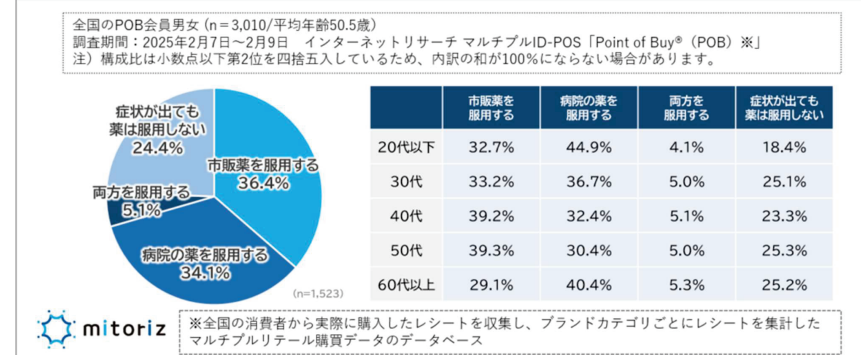


3 | 田辺ファーマ

## 2. 市場調査 花粉症における市販薬の使用状況

「病院の薬を服用する」34.1%、「症状が出ても薬は服用しない」24.4%、合わせて**58.5%は市販薬を服用していない**・・・セルフメディケーション拡大の可能性あり

図表3) 花粉症に対する薬の使用について

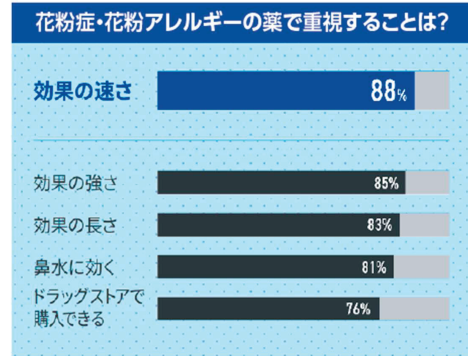


4 | 田辺ファーマ

(株式会社mitoriz調べ)

## 2.市場調査 花粉症における市販薬の重視ポイント

市販の花粉症・花粉アレルギーのお薬を買っている人の**約88%が「効果の速さ」を重視している**・・・お薬選択のポイント



Q. あなたは市販のアレルギー性鼻炎薬（飲み薬）を購入する際に、どのような点を重視しますか？

※単位は%  
※5段階のTOP2(重視している、やや重視しているの合計値)

調査対象：男女 20-69才 以下条件に当てはまる1545人

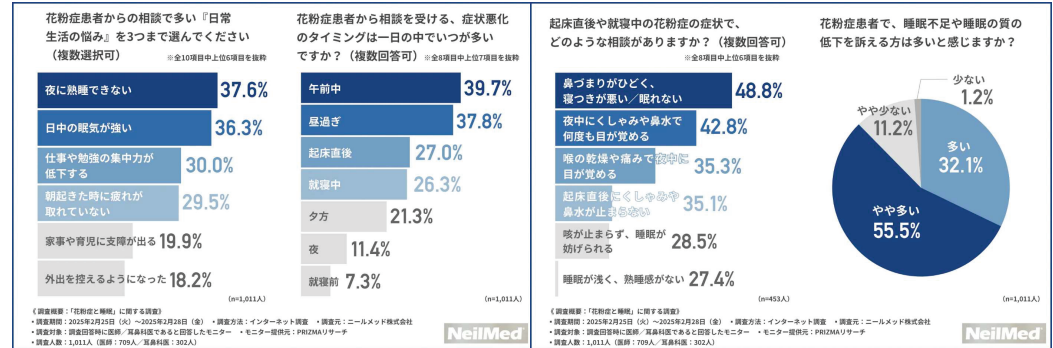
<対象者条件>

- ・花粉症罹患状態で1年以内に何かしらの対策を実施している
- ・(よりよいものがあれば)今まで使用していないブランドの市販薬を使用しても良い(市販薬スイッチに拒否感なし)
- ・(市販薬使用者のみ追加条件)花粉症対策商材について自分で選択し、自分で購入している

調査委託先：株式会社 H.M.マーケティングリサーチ

## 2.市場調査 花粉症と睡眠の関係

花粉症患者の「日常生活の悩み」のトップは**夜に熟睡できない(37.6%)**  
鼻づまりがひどく、寝つきが悪い/眠れないが約半数を占め、**睡眠に悪影響**  
➤ **夜間の鼻づまりでQOLが低下**



## 3.花粉症発症のメカニズム

ヒスタミンとは・・・

ヒスタミンは、肺、肝臓、胃、大脳など**生体に広く分布**しています。

通常は、**肥満細胞と好中球の中の顆粒に含まれて存在**しています。

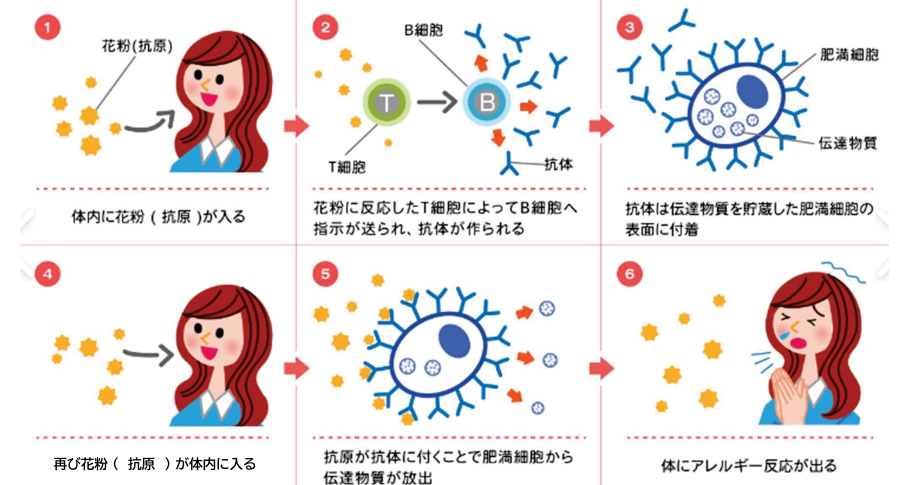
ヒスタミンは、ヘパリンというタンパク質と結合して**不活化状態で存在**し、肥満細胞の表面でIgE抗体が抗原と結合して、**抗原抗体反応が起こったとき、肥満細胞から飛び出て遊離し、活性化し、アレルギー反応を促進**します。これを**脱顆粒**といいます。

ヒスタミンは、**外傷、熱傷**などの物理的侵襲、**毒物、薬物**などの化学的侵襲でも、**遊離し活性化**します。

ヒスタミンは、生体のアレルギー反応を促進するだけでなく、**ときにアナフィラキシーショック**を起こします。



## 3.花粉症発症のメカニズム



### 3.花粉症発症のメカニズム（参考）

4つのヒスタミンのはたらきと受容体

ヒスタミンのはたらきは、**炎症、アレルギー反応、胃酸分泌、神経伝達**に関与しています。

細胞の表面にある受容体を介して作用を発現させます。

4種類の受容体(H1～H4)があり、それぞれ異なる作用を示します。

#### H1受容体

炎症およびI型アレルギー反応に関与する受容体であり、**気管支喘息、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹**やアナフィラキシーの症状を引き起こします。そのため、**H1受容体へのヒスタミンの結合を阻害する薬**が、これらの疾患の治療に用いられます。



### 3.花粉症発症のメカニズム（参考）

#### H2受容体

・ヒスタミンと胃酸分泌

胃壁細胞は、胃内を酸性に保つためにH<sup>+</sup>(胃酸)を持続的に分泌しています。**胃酸分泌は、胃壁粘膜の細胞に存在するヒスタミン受容体、ガストリン受容体、ムスカリン受容体を介して行われます。**この中では、**ヒスタミン受容体(H2受容体)が最も強い。**

ヒスタミン2受容体をブロックする(H2ブロッカー)ことで胃酸分泌を抑制し、胃潰瘍および十二指腸潰瘍の治療を行います。

#### H3受容体

脳の神経系細胞に存在し、神経伝達物質の量を調整することにより、神経伝達に関与しています。

#### H4受容体

脾臓や胸腺といった免疫組織および免疫系細胞に存在し、免疫調節に関与しています。

### 3.花粉症発症のメカニズム 飛散開始日

「初観測日」は1月1日以降はじめて花粉を観測した日をいいます。  
 「飛散開始日」は、1cm<sup>3</sup>あたり1個以上の花粉を2日以上連続して観測された初日をいい「本格的に」花粉が飛び始めた日という意味になります。  
 花粉症治療ではいかに早く**抗ヒスタミン薬を服用開始**するかがポイントになります。

飛散開始日 = 抗ヒスタミン薬(OTC)の服用開始



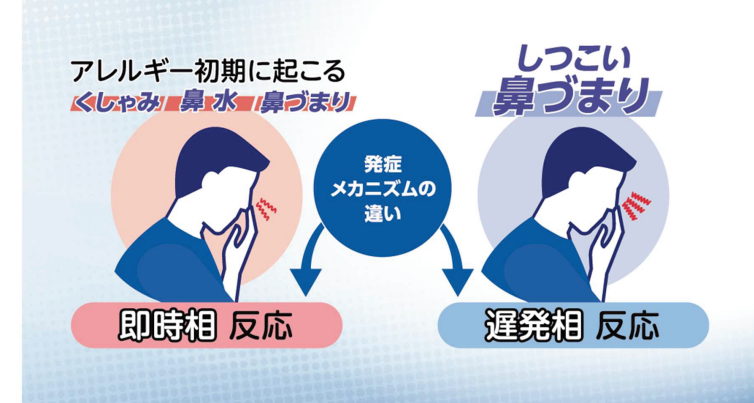
ウェザーニュースのポールンロボ (全国1000カ所)



医療機関では花粉飛散前から予防的な服用が推奨されています

### 3.花粉症発症のメカニズム 2つの発症メカニズム

アレルギー性鼻炎は「即時相反応」と「遅発相反応」という異なるメカニズムによって生じる**症状が混在**します。



### 3.花粉症発症のメカニズム 即時相反応

即時相反応はIgE抗体と肥満細胞が関係しています。花粉を吸い込むと**すぐに発症**し、くしゃみ、鼻水が主な症状です。花粉がない環境に移動すれば比較的早く症状が治まります。主にヒスタミンによる発症のため**抗ヒスタミン薬が良く効きます**。



### 3.花粉症発症のメカニズム 遅発相反応

遅発相反応は**炎症細胞(好酸球)**が関係しています。花粉を吸い込み**半日ほど後に発症**し、**しつこい鼻づまり**が主な症状です。ヒスタミンだけでなくサイトカインやロイコトリエンが関与しているため**抗ヒスタミン薬が効きにくい**といわれています。



### 4.ガイドラインに基づくセルフメディケーション

アレルギー性鼻炎の薬物療法は、**全ての重症度、病型において第2世代抗ヒスタミン剤が推奨**されています。特に鼻閉型では「**鼻噴霧用ステロイド薬の併用**」あるいは「**抗ヒ+血管収縮剤**」が推奨されています。(参考:ガイドライン)

重症度	初期療法	軽症	中等症		重症・最重症	
			くしゃみ・鼻漏型	鼻閉型または完全型	くしゃみ・鼻漏型	鼻閉型または完全型
治療	①第2世代抗ヒスタミン薬	①第2世代抗ヒスタミン薬	②第2世代抗ヒスタミン薬	抗LTs薬または抗PGD <sub>2</sub> ・TXA <sub>2</sub> 薬	②第2世代抗ヒスタミン薬	③第2世代抗ヒスタミン薬
	②遊離抑制薬 ③抗LTs薬 ④抗PGD <sub>2</sub> ・TXA <sub>2</sub> 薬 ⑤Th2サイトカイン阻害薬 ⑥鼻噴霧用ステロイド薬	②抗LTs薬 ③抗PGD <sub>2</sub> ・TXA <sub>2</sub> 薬 ④鼻噴霧用ステロイド薬	鼻噴霧用ステロイド薬	鼻噴霧用ステロイド薬	②第2世代抗ヒスタミン薬 もしくは 第2世代抗ヒスタミン薬・血管収縮薬配合剤*	③第2世代抗ヒスタミン薬
				鼻噴霧用ステロイド薬	鼻噴霧用ステロイド薬	鼻噴霧用ステロイド薬
					⑤第2世代抗ヒスタミン薬・血管収縮薬配合剤*	⑤第2世代抗ヒスタミン薬・血管収縮薬配合剤*
					鼻噴霧用ステロイド薬	鼻噴霧用ステロイド薬
						点鼻用血管収縮薬または経口ステロイド薬***

### 5.抗ヒスタミン薬 様々な第2世代抗ヒスタミン薬

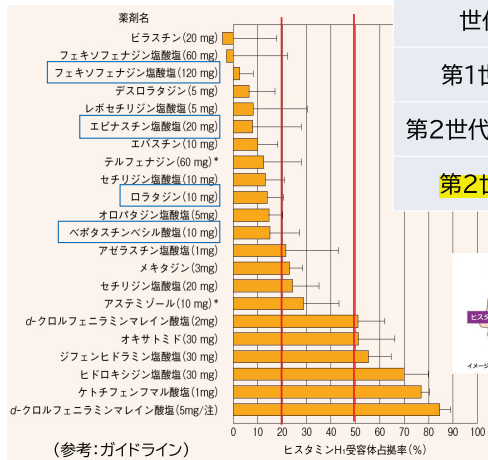
第1世代抗ヒスタミン薬は、速効性はあるものの、効果の持続は短く、中枢抑制による鎮静作用、眠気認知能低下、抗コリン作用が強い。第2世代抗ヒスタミン薬は抗ヒスタミン作用の他に**多彩なアレルギー作用**を有することで**鼻閉にも効果**を有し、**鎮静作用、抗コリン作用が軽減**されています。

第2世代抗ヒスタミン薬の医療用での発売年(日本)とスイッチ状況

発売日	成分名	医療用(先発)	OTC
1983年	ケトチフェン	ザジテン	ザジテンAL(グラクソ・スミスクライン)
1986年	アゼラスチン	アゼブチン	スルーロンAL(協和薬品)、ムヒAZ錠(日東薬品工業)
1987年	オキサトミド	セルテクト	
1990年	テルフェナジン	トリルダグ	
1990年	メキタジン	ニボラジン、ゼスラン	ストナリニガード(佐藤製薬)
1993年	エメダスチン	ダレン、レミカット	
1994年	エピナスチン	アレジオン	<b>アレジオン20</b> (エスエス製薬) (アレジオン10, <b>2011年10月</b> )
1996年	エバスタチン	エバステル	エバステルAL(興和)
1998年	セチリジン	ジルテック	コンタック鼻炎Z(グラクソ・スミスクライン)、ストナリニZ(佐藤製薬)
2000年	ベボタスチン	タリオン	<b>2020年12月タリオンAR</b> (田辺三菱製薬)
2000年	フェキソフェナジン	アレグラ	<b>2012年11月アレグラFX</b> (久光製薬)、ノスポール鼻炎錠FX(協和薬品)ほか
2001年	オロパタジン	アレロック、パタノール	
2002年	ロラタジン	クラリチン	<b>2017年1月クラリチンEX</b> (大正製薬)
2010年12月	レボセチリジン	ザイザル	
2016年11月	デスロラタジン	デザレックス	
2016年11月	ピラスチン	ピラノア	
2017年11月	ルパタジン	ルバフィン	

## 5.抗ヒスタミン薬 鎮静作用

抗ヒスタミン薬の分類



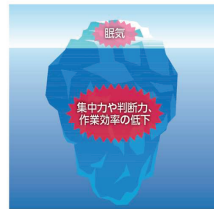
世代	脳内H1受容体占拠率	鎮静作用
第1世代	50%以上	鎮静性
第2世代(初期)	20%~50%未満	軽度鎮静性
<b>第2世代</b>	<b>20%未満</b>	<b>非鎮静性</b>



### インベアード・パフォーマンス

自覚できる

自覚しにくい



## 5.抗ヒスタミン薬 基本骨格による分類

第2世代抗ヒスタミン薬は基本骨格によって3つに分類されます。薬剤の効き方は人それぞれです。効き目が不十分な時には分類も含めて変更することがセオリーです。

**エピナスチン ロラタジン ⇄ ベボタスチン フェキソフェナジン**

三環系骨格	ピペリジン骨格	ピペラジン骨格
エピナスチン	フェキソフェナジン	セチリジン
オロパタジン	エバスチン	レボセチリジン <span style="border: 1px solid black; padding: 2px;">光学異性体</span>
デスロラタジン	ベボタスチン	
ロラタジン	ピラスチン	
ルパタジン		
ケチフェン		

ロラタジン、ルパタジンは代謝されデスロラタジンとなり活性を示す

## 5.抗ヒスタミン薬 スイッチ成分 注意等まとめ

第2世代抗ヒスタミン薬のスイッチ4成分の、**用法・用量、運転や機械類操作**の注意、**禁忌事項**の違いを把握の上、お薬選びのサポートをお願いします

成分名	効能	用法	運転	禁忌
ベボタスチン	同一	1日2回朝夕	禁止	腎臓病禁忌
フェキソフェナジン	同一	1日2回朝夕		Mg含有制酸剤、エリスロマイシン、アバルタミド(前立腺ガン治療剤)
エピナスチン	同一	1日1回 <b>就寝前</b>	禁止	肝臓病禁忌
ロラタジン	同一	1日1回 <b>同時間帯</b>		エリスロマイシン、シメチジン

【効能】花粉、ハウスダスト(室内塵)などによる次のような鼻のアレルギー症状の緩和:くしゃみ、鼻みず、鼻づまり  
4成分すべて第2類医薬品です。

## タリオンARのご紹介

6.タリオンARのご紹介

タリオンAR 第2類医薬品

# タリオンARの3つの特長



【効能】花粉、ハウスダスト(室内塵)などによる次のような鼻のアレルギー症状の緩和:くしゃみ、鼻みず、鼻づまり

**特長 1** 速やかに体内に吸収され効果を発揮します。

**特長 2** くしゃみ、鼻水はもちろん、しつこい鼻づまりにも効きます。

**特長 3** 中枢抑制作用が少なく眠くなりにくい。

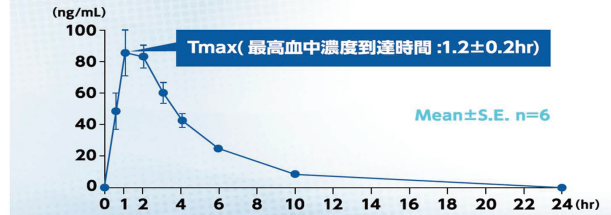
6.タリオンARのご紹介

**特長 1** 速やかに体内に吸収され効果を発揮します。



タリオンARの血中濃度推移

血中濃度がピークになるまでの時間が速い



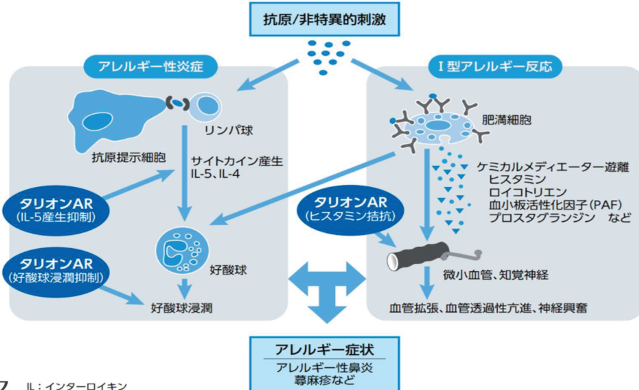
<試験概要> 対象:健康成人男性6名  
方法:ベボタスタンベシル酸塩10mg(普通錠)を単回投与し、投与後24時間までの血中ベボタスタン濃度の推移を検討した。  
副作用:試験の全期間において重大な副作用は発生しなかった。  
出典:承認申請書添付資料

6.タリオンARのご紹介

**特長 2** くしゃみ、鼻水はもちろん、しつこい鼻づまりにも効きます。

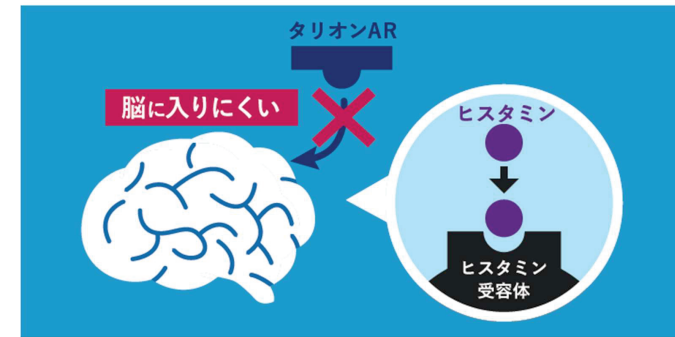


**Point!** 炎症細胞のはたらきを抑え、寝苦しい鼻づまりにもしっかり効く



6.タリオンARのご紹介

**特長 3** 中枢抑制作用が少なく眠くなりにくい。



タリオンARは脳に入りにくいので、  
集中力・判断力・作業能率の低下が起こりにくく、眠くなりにくい

ご清聴ありがとうございました