

## 抗ヒスタミン薬の鎮静作用

抗ヒスタミン薬を服用すると集中力や判断力，作業能率が低下することがあります。これは抗ヒスタミン薬の副作用のひとつで，インペアード・パフォーマンス<sup>1)</sup>と言われています。インペアード・パフォーマンスの起こる要因の一つに抗ヒスタミン薬がもつ鎮静作用があげられます。今回は抗ヒスタミン薬の鎮静作用をとりあげてみました。中枢のヒスタミン神経は覚醒時に強く興奮してヒスタミンを遊離し，大脳皮質機能を強力に賦活させます。反対に抗ヒスタミン薬の鎮静作用は抗ヒスタミン薬が脳内ヒスタミン1 (H1) 受容体を50%以上占拠することで発現します。H1受容体占拠率は薬剤で大きく異なっており，抗ヒスタミン薬の鎮静作用の強さはこの占拠率に比例すると言われています。

東北大学大学院薬理学分野の谷内一彦教授は，抗ヒスタミン薬をH1受容体占拠率により「非鎮静性」，「軽度鎮静性」，「鎮静性」に分類しました。それぞれのH1受容体占拠率は「非鎮静性」が20%未満，「軽度鎮静性」が20%以上～50%未満，「鎮静性」が50%以上となっています<sup>2)</sup>。表1は抗ヒスタミン薬をH1受容体占拠率により分類したものです。

第1世代抗ヒスタミン薬は全て鎮静性に分類されますが，第2世代の抗ヒスタミン薬の中でセルテクト，ザジテンは鎮静性に分類され，アゼプチン，ゼスラン，ジルテックは軽度鎮静性に分類されています。これらの薬剤はインペアード・パフォーマンスが起りやすく，自動車の運転や危険な作業を行う場合には注意が必要です。

表1 抗ヒスタミン薬の鎮静作用による分類

鎮静作用	一般名	商品名	剤形	推奨用量 <sup>注)</sup>	世代
非鎮静性	フェキソフェナジン塩酸塩	アレグラ	錠：30mg, 60mg, OD錠：60mg, DS	120mg	第2世代
	塩酸エピナスチン	アレジオン	錠：10mg, 20mg, DS	20mg	第2世代
	エバスチン	エバステル	錠：5mg, 10mg, OD錠：5mg, DS	10mg	第2世代
	ロラタジン	クラリチン	錠：10mg, レディタブ錠：10mg	10mg	第2世代
	セチリジン塩酸塩	ジルテック	錠：5mg, 10mg, DS	10mg	第2世代
	オロパタジン塩酸塩	アレロック	顆粒：0.5%, 錠：2.5mg, 5mg, OD錠：2.5mg, 5mg	5mg	第2世代
軽度鎮静性	ベンシル酸ベポタスチン	タリオン	錠：5mg, 10mg, OD錠：5mg, 10mg	10mg	第2世代
	アゼラスチン塩酸塩	アゼプチン	顆粒：0.2% (2mg/g), 錠：0.5mg, 1mg	1mg	第2世代
	メキタジン	ゼスラン	錠：3mg, 小児用細粒：0.6% (6mg/g), 小児用シロップ：0.03% (0.3mg/ml)	30mg	第2世代
	セチリジン塩酸塩	ジルテック	錠：5mg, 10mg, DS：1.25% (12.5mg/g)	20mg	第2世代

鎮 静 性	オキサトミド	セルテクト	錠：30mg, DS：2% (20mg/g)	30mg	第2世代
	ケトチフェン フマル酸塩	ザジテン	DS：0.1% (1mg/g), カプセル：1mg, シロップ：0.02% (0.2mg/ml)	1mg	第2世代
	d-クロルフェニラミン マレイン酸	ポララミンなど	散：1%, 錠：2mg, シロップ：0.04% (0.4mg/ml), DS：0.2%, 注：5mg1ml	20mg	第1世代
	ジフェンヒドラミン 塩酸塩	レスタミンコーワなど	錠：10mg	30mg	第1世代
	クレマスチン フマル酸塩	タベジールなど	散：0.1%, 1%, 錠：1mg	1mg	第1世代
	ヒドロキシジン 塩酸塩	アタラックスなど	錠：10mg, 25mg, 注25mg/ml, 50mg/ml, 散10%, カプセル：25mg, 50mg, シロッ プ：0.5% (5mg/ml), DS：2.5%	30mg	第1世代

OD錠：口腔内崩壊錠, DS：ドライシロップ

注) 表の推奨用量は成人量に記載しています。

### 【参考文献】

- 1) 熊谷雄治：薬理学から見たインペアード・パフォーマンス, アレルギーの臨床30(14)：28-33, 2010
- 2) 谷内一彦, 田代 学 他：中枢に移行しない第2世代抗ヒスタミン薬：PETによる脳内移行性に関する研究, 西日本皮膚科71(1)：3-6, 2009

(鹿児島市医師会病院薬剤部 高橋 武士)