99-268

問題文

32歳女性。消化器外来に通院中。数日前からじん麻疹を発症し、抗アレルギー薬が追加処方されることになった。担当医師から薬剤師に対して、「患者がなるべく眠くならない薬剤を希望しているが、推奨できるものは何か」と問い合わせがあった。

問268

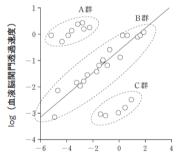
薬剤師が推奨すべき抗アレルギー薬として、最も適切なのはどれか。1つ選べ。

- 1. シプロヘプタジン塩酸塩水和物
- 2. エバスチン
- 3. フェキソフェナジン塩酸塩
- 4. セチリジン塩酸塩
- 5. ホモクロルシクリジン塩酸塩

問269

図は薬物の血液脳関門透過速度と1-オクタノール/水分配係数の関係を示したものである。前問で選択した薬物について、正しい記述はどれか。1つ選べ。

ただし、B群の薬物においては血液脳関門透過速度と分子量で補正した分配係数との間に、図に示す直線関係がみられている。



log (分子量で補正した分配係数)

- 1. アミノ酸やグルコースなどの栄養物質と同様にA群に属する。
- 2. B群に属し、血液脳関門透過はpH分配仮説に従う。
- 3. B群に属し、脳内への移行にトランスポーターが関与している。
- 4. レボドパやバクロフェンと同様にC群に属する。
- 5. C群に属し、P-糖タンパク質によって脳内への移行が妨げられる。

解答

問268:3問269:5

解説

問268

眠くなりにくい抗アレルギー薬といえば第一に、フェキソフェナジン(アレグラ)です。添付文書に服用時の 自動車運転等への注意記載がなく、推奨できると考えられます。(ちなみに、選択肢にはありませんがロラタ ジン(クラリチン)も、注意記載がありません。)

以上より、正解は3です。

ちなみに、シプロヘプタジンは商品名がペリアクチンです。小児用シロップで実習等でよく見かけたのではないかと思います。

エバスチンは、商品名がエバステルです。第二世代抗ヒスタミン薬です。眠気は少ないと言われていますが添付文書には、運転などに注意喚起があります。

セチリジンは、商品名がジルテックです。第二世代抗ヒスタミン薬です。エバスチンと同様、眠気は少ないと 言われていますが添付文書には、運転などに注意喚起があります。

ホモクロルシクリジンは、商品名がホモクロミンです。第一世代抗ヒスタミン薬です。比較的速効性がある抗アレルギー薬です。

問269

フェキソフェナジン(アレグラ)は、P-糖タンパク質 (P-gp) の基質の一つです。脳内移行が妨げられる事が知られています。これにより、脂溶性と、脳関門通過速度が単純な比例関係ではなく脂溶性の割に、通過速度が小さくなります。つまり、図の C 群に属します。

以上より、正解は5です。

ちなみに「フェキソフェナジンが、P-gp の基質の一つ」と知らなくても「第二世代の抗ヒスタミン薬の中でもとりわけ眠気が少ないと評価されている」 \rightarrow 「眠気が少ない=中枢移行が少ない?」 \rightarrow 「特別な排出機構があるのではないか?」 \rightarrow 「排出機構といえば、P-gp が代表的」と推測していくことで、正解に辿り着けるのではないかと考えられます。