

サノフィ株式会社

ディレグラ配合錠

2.2 緒言

Total number of pages: 3

2.2 緒言

ディレグラ配合錠 -

ディレグラ配合錠は、フェキソフェナジン塩酸塩 30 mg と塩酸プソイドエフェドリン 60 mg を含有する配合剤である。

有効成分のひとつであるフェキソフェナジン塩酸塩は、中枢神経系抑制作用が極めて低いことを特徴とする抗アレルギー薬である。その主作用は選択的ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用であり、さらにケミカルメディエーター遊離抑制作用、炎症性サイトカイン産生抑制作用及び好酸球遊走抑制作用ならびに I 型及び IV 型アレルギー反応に対する抑制作用を示すことが薬理試験で確かめられている。これまでに実施された臨床試験から、臨床的にヒスタミンが関与しているとされるアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、アトピー性皮膚炎をはじめとするそう痒性皮膚疾患に対しその有用性が確認されており、フェキソフェナジン塩酸塩を有効成分とするアレグラ錠は、米国、欧州をはじめ世界 100 か国以上で承認されている。本邦においてアレグラ錠は、7 歳以上の小児及び成人を対象とし「アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、アトピー性皮膚炎）に伴うそう痒」を効能又は効果として市販されている。

他方、塩酸プソイドエフェドリンは、本邦では単味製剤としては販売されていないが「鼻炎用内服薬製造（輸入）承認基準」に鼻炎症状の緩和を目的とした成分として収載されており、強い鎮静作用を副作用として有する第一世代の抗ヒスタミン薬との組み合わせで鼻炎用内服薬やかぜ薬に配合され一般用医薬品に用いられている。

ディレグラ配合錠は、海外で市販されている Allegra-D12（フェキソフェナジン塩酸塩 60 mg、塩酸プソイドエフェドリン 120 mg を含有）の製剤技術を基に、1 錠中のプソイドエフェドリンとしての配合割合が 10%以下となるよう賦形剤の量を変えて製造した日本国内専用の配合剤である。日本国内での開発を進めるにあたっては医薬品医療機器総合機構との医薬品第 I 相開始前相談を行い、フェキソフェナジン塩酸塩／塩酸プソイドエフェドリン配合剤とフェキソフェナジン塩酸塩の市販製剤（アレグラ錠 60 mg）の相対的バイオアベイラビリティ試験（BDR11250 試験）、食事の影響試験（ALI 11251 試験）及び 12 歳以上の季節性アレルギー性鼻炎患者を対象に塩酸プソイドエフェドリンの用量検討及びフェキソフェナジン塩酸塩／塩酸プソイドエフェドリン配合剤の有効性／安全性を検討することを目的とした第 II/III 相臨床試験（EFC11243 試験）を実施した。その結果、日本人における相対的バイオアベイラビリティ、食事の影響、有効性及び安全性が確認されたことから、本邦での製造販売承認申請を行うこととした。なお、フェキソフェナジン塩酸塩の非臨床成績は単剤での承認申請において既に評価済みであり、プソイドエフェドリンについても一般用医薬品の成分として認められているもので十分な検討がなされているものと判断している。また両剤を併用した場合の薬物相互作用を起こす可能性は低いと考えられることから国内開発を進めるに際して追加の非臨床試験は必要ないことについて対面助言にて確認の上、実施しなかった。

2.2 緒言

ディレグラ配合錠 -

予定する効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりである。

【効能又は効果】：アレルギー性鼻炎

【用法及び用量】：通常、成人及び12歳以上の小児には1回2錠（フェキソフェナジン塩酸塩として60 mg及び塩酸プソイドエフェドリンとして120 mg）を1日2回、朝及び夕の空腹時に経口投与する。