

不眠症治療薬（デエビゴ®錠）

2020年7月、不眠症治療薬のデエビゴ®錠（一般名：レンボレキサント）が発売されました。ベルソムラ®錠（一般名：スポレキサント）に続く2剤目のオレキシン受容体拮抗薬です。

不眠症治療薬は、ベンゾジアゼピン（BZ）受容体作動薬や非 BZ 受容体作動薬のように GABA 受容体を介して脳全体を鎮静させる薬とメラトニン受容体作動薬やオレキシン受容体拮抗薬のように自然に近い眠気を促す薬に分類されます。BZ 系・非 BZ 系薬は、長い間、不眠症治療の中核を担ってきました。催眠・鎮静、抗不安、筋弛緩、抗けいれんなどの薬理作用があります。近年、記憶障害やふらつきによる転倒・骨折、長期連用時の常用量依存などが問題視され、向精神薬の多剤併用に対する減算処置など、規制が強化されています。

オレキシンは、現・筑波大学の柳沢正史、櫻井武らが米テキサス大学でナルコレプシー（居眠り病）の研究中に発見した神経ペプチドです。オレキシン受容体には 2 つのサブタイプ（OX1R、OX2R）があり、覚醒及び睡眠を調節しています。オレキシン受容体拮抗薬は、オレキシン受容体を阻害して、脳を覚醒状態から睡眠状態へ移行させます。BZ 系薬のような切れ味はないですが、依存性や耐性が少なく、せん妄や反跳性不眠が起こりにくい薬です。BZ 系・非 BZ 系薬よりも安全性が高く、メラトニン受容体作動薬よりも効果発現が早い不眠症治療薬です。効果発現が早いため、就寝直前に服用します。なお、食事と同時または食直後の服用により、効果発現が遅くなる可能性があります。副作用として悪夢や翌朝の眠気、頭痛、倦怠感などがあります。ほかの眠剤と同様に自動車の運転等は避けるよう注意が必要です。デエビゴは、CYP の影響を受けにくく、ベルソムラが併用禁忌の CYP3A を強く阻害するイトラコナゾール、クラリスロマイシン、ボリコナゾールが併用注意になりました。ただし、用量は 1 回 2.5mg に減量します。デエビゴは、一包化調剤が可能です。

商品名	デエビゴ®錠	ベルソムラ®錠
一般名	レンボレキサント	スポレキサント
会社	エーザイ株式会社	MSD 株式会社
適応	不眠症	不眠症
用法・用量	成人には 1日1回5mg、最大10mg、 併用注意薬投与中は2.5mgを 就寝直前に投与	成人には1日1回20mg、 高齢者には1日1回15mg、 併用注意薬投与中は10mgを 就寝直前に投与
禁忌	重度の肝機能障害	CYP3A を強く阻害する薬 (イトラコナゾール、 クラリスロマイシン、 ボリコナゾールなど)
薬価	2.5mg : 57.30 円 5mg : 90.80 円 10mg : 136.20 円	10mg : 69.30 円 15mg : 90.80 円 20mg : 109.90 円

使用に際しては、添付文書を必ずお読み下さい。

オレキシン受容体拮抗薬

	デエビゴ	ベルソムラ
一般名	レンボレキサント	スポレキサント
適応症	不眠症	不眠症
選択性	OX1R < OX2R	OX1R ≦ OX2R
禁忌	重度の肝機能障害	CYP3A を強く阻害する薬剤 イトラコナゾール、クラリスロマイシン、 リトナビル、ネルフィナビル、 テラプレビル、ボリコナゾール
併用注意	イトラコナゾール、クラリスロマイシン、 エリスロマイシン、フルコナゾール、 ペラバミル等	ジルチアゼム、ペラバミル、 フルコナゾール等
用法・用量	5mg…通常 10mg…最大 2.5mg…併用注意薬投与中	20mg…成人 15mg…高齢者 10mg…併用注意薬投与中
一包化	可能	不可

OX1R：オレキシン1受容体、OX2R：オレキシン2受容体
*近年の基礎研究において、OX2Rの方が睡眠・覚醒リズムの調節により重要な役割を担っていることが示唆されている