

# コンパス薬局瀬谷 スキルアップ勉強会

2015. 11. 16 作佐部

## 第 45 回『ベルソムラ錠』

MSD株式会社 菊池 真理子さん

参加者：近藤、佐藤、小西、青野、梅津、作佐部

日本において3人に1人は不眠症と言われている。不眠症治療薬のマーケットは約900億円で糖尿病治療薬とほぼ変わらない。これまでバルビツール・非バルビツール酸系→ベンゾ・非ベンゾジアゼピン系→メラトニン受容体作動薬と様々なクラスが登場してきたが、ベルソムラは1998年に2人の日本人科学者によって発見されたオレキシンをターゲットに開発された、世界初のオレキシン受容体拮抗薬である。

名前の由来は Bel (美しい) som (眠り)。

### 【効能・効果】

不眠症

### 効能・効果に関連する使用上の注意

二次性不眠症に対する本剤の有効性及び安全性は確立されていない。

### 【用法用量】

通常、成人にはスボレキサントとして1日1回20mgを、高齢者には1日1回15mgを就寝直前に経口投与する。

### 用法及び用量に関連する使用上の注意

1. 本剤は就寝の直前に服用させること。また、服用して就寝した後、睡眠途中で一時的に起床して仕事等で活動する可能性があるときは服用させないこと。
2. 入眠効果の発現が遅れるおそれがあるため、本剤の食事と同時又は食直後の服用は避けること。〔食後投与では、空腹時投与に比べ、投与直後のスボレキサントの血漿中濃度が低下することがある。〕
3. 他の不眠症治療薬と併用したときの有効性及び安全性は確立されていない。

### 【作用機序】

スボレキサントは、覚醒を促進する神経ペプチドであるオレキシンA及びBのOX<sub>1</sub>及びOX<sub>2</sub>受容体への結合を可逆的に阻害することにより、脳を覚醒状態から睡眠状態へ移行させ、睡眠を誘発すると考えられる。

### 【特徴】

高齢者に使いやすい薬剤である。

- ・筋弛緩などの副作用が少ないことから転倒のリスクが少ない。
- ・単剤での効果が期待できる。
- ・中止の際の反跳性不眠及び退薬症候が生じにくい。

### 【副作用】

不眠症患者を対象とした第 III 相国際共同試験では、254 例（日本人 61 例）に本剤（成人：20mg、高齢者：15mg）が投与された。この試験の 6 ヶ月間の副作用は 53 例（20.9%）に認められた。主な副作用は、傾眠（4.7%）、頭痛（3.9%）、疲労（2.4%）であった。

### 【考察】

BZD系に比べ副作用が少ない観点から高齢者に使いやすいとされている。BZD系からの切り替えの際は反跳性不眠に注意が必要で、薬が慣れるまで 3~7 日は我慢しなくてはならない。また食事により血漿中濃度が低下するため、食後の服用は避けるよう注意を促す必要がある。12 月 1 日より投薬期間制限が解除されるため、今後市場に出てくる割合が増えると予想される。

### 【質問事項】

Q. よく使われる薬の中で注意しなくてはいけない薬剤は？

A. クラリスロマイシン(CYP3A を強く阻害することにより、ベルソムラの代謝が阻害される)→併用禁忌

Q. 慣れて効かなくなることはあるのか？

A. あまりそのような話は聞かない。

Q. Tmax、t1/2 は？

A. 空腹時 Tmax : 1.5 時間、食後 Tmax : 3 時間、空腹時 t1/2 : 10.0±1.0 時間、食後 t1/2 : 10.7±1.8 時間

以上