

ディレグラ配合錠 Q&A リスト

分類	内容
製剤	ディレグラ配合錠は粉碎投与が可能ですか。
製剤	ディレグラ配合錠の半錠分割は可能ですか。
用法・用量	ディレグラ配合錠の用法・用量で、空腹時投与の理由を教えてください。
用法・用量	ディレグラ配合錠の服用は空腹時とありますが、具体的な指標はありますか。
安全性	ディレグラ配合錠の禁忌として「重症の高血圧の患者」とあるが、その目安を教えてください。
投与期間	ディレグラ配合錠は長期処方が可能ですか。
その他	ディレグラ配合錠はドーピングの禁止物質に該当しますか。
用法・用量	適宜増減の記載がないが、増量、減量が可能ですか。
安全性	ディレグラ配合錠は抗コリン作用がありますか。
製剤	殻錠(ゴーストタブレット)が排泄されるとあるが、どのようなものですか。
製剤	殻錠の成分、および色、形、大きさ、硬さを教えてください。
製剤	殻錠が出る頻度を教えてください。
製剤	適用上の注意に、「本剤は徐放層を含む錠剤」と記載されていますが、これはどのようなことですか。
臨床	食前・食後投与の臨床効果を比較した報告がありますか。



目次へ戻る

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

製剤

【質問】

ディレグラ配合錠は粉碎投与が可能ですか。

【回答】

ディレグラ配合錠の粉碎投与はできません。

ディレグラ配合錠の塩酸プソイドエフェドリン(PSE)含有層は徐放化構造となっているため、錠剤を粉碎すると徐放できなくなることから、薬剤の吸収、排泄等が変化し、臨床効果や安全性に影響を与える可能性があります。したがって、ディレグラ配合錠は粉碎投与しないよう、お願いいたします。

参考資料

ディレグラ配合錠 インタビューフォーム VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

14. 適用上の注意



【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

製剤

【質問】

ディレグラ配合錠の半錠分割は可能ですか。

【回答】

ディレグラ配合錠の半錠分割はできません。

ディレグラ配合錠は割線がないため、分割した場合の含量均一性を担保出来ません。また、塩酸プソイドエフェドリン(PSE)含有層の徐放化に影響を与え、臨床効果や安全性に影響を与える可能性があります。

参考資料

ディレグラ配合錠 インタビューフォーム VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

14. 適用上の注意

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

用法・用量

【質問】

ディレグラ配合錠の用法・用量で、空腹時投与の理由を教えてください。

【回答】

ディレグラ配合錠の食事の影響を検討した結果、空腹時に比べて食後に服用した場合、フェキソフェナジン塩酸塩のバイオアベイラビリティが低下したことから、臨床試験は空腹時投与で行われました。その結果、空腹時投与の用法で承認されました。

日本人健康成人男子にディレグラ配合錠 2 錠を空腹時及び食後に単回投与したとき、血漿中フェキソフェナジンの t_{max} は食事によって延長する傾向が見られ、 C_{max} 、 AUC_{0-72} (平均) は食事により低下する傾向が見られました^{1,2)}。

表 VII-5. 日本人健康成人男子に FEX/PSE 配合錠 (FEX60mg/PSE120mg) を空腹時及び食後に単回投与したときの血漿中フェキソフェナジンの薬物動態パラメータ^{1,2)}

薬物動態パラメータ	空腹時投与 (n=18)	食後投与 (n=17)
C_{max} (ng/mL)	350 ± 143	117 ± 27.3
t_{max} (h) ※)	1.50 (0.50-3.00)	3.00 (1.00-5.00)
AUC_{0-72} (ng·h/mL)	2080 ± 602	770 ± 185
$t_{1/2z}$ (h)	12.2 ± 6.05	16.4 ± 8.29

(平均値 ± SD)、※): 中央値 (最少-最大)

参考資料

- 1)【ALI11251 試験】FEX/PSE 配合錠の第 I 相臨床試験 (食事の影響および安全性の検討) (2012 年 12 月 25 日承認、CTD2.7.6.2)
- 2)ディレグラ配合錠 インタビューフォーム VII. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

用法・用量

【質問】

ディレグラ配合錠の服用は空腹時とありますが、具体的な指標はありますか。

【回答】

ディレグラ配合錠の食後の服用は、フェキソフェナジン塩酸塩のバイオアベイラビリティが低下するため期待する効果が発揮されない可能性があります¹⁾。効果が最大限発揮されるよう、例えば「起床時、夕方の空腹時」や「朝食前、夕食前」に服用していただくようお願いします。

[参考]

ディレグラ配合錠 添付文書

6. 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60mg及び塩酸ブソドエフェドリンとして120mg)を1日2回、朝及び夕の空腹時に経口投与する。

●患者向け資料「ディレグラ配合錠を服用する患者さんへ」には服用タイミングについて以下のように記載されています。

「…すみやかに鼻づまりを改善させるためには、起床時と夕方の空腹時に飲むのが最適です。鼻づまりを感じる時、薬の効果が最大限に発揮されるように、食後ではなく、空腹時※に飲むようご注意ください。※空腹時とは、食事の直後以外の、胃の中に食べ物が入っていない時のこと」

●国内臨床試験(PhaseII/III)²⁾では、朝食及び夕食の1時間以上前又は2時間以上後に服薬するという試験デザインで実施しましたが、国内臨床試験での服薬タイミングは、有効性評価に食事の影響を受けない厳しい条件となります。従って、この条件を日常の服薬指導の目安にすることはお勧めできません。服用タイミングが食事に縛られてしまうと、食事の時間が不規則な患者さんではディレグラを服薬できず、結果、鼻症状がコントロールできなくなる可能性があります。

参考資料

- 1)ディレグラ配合錠 インタビューフォーム VII. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移
- 2)大久保公裕:アレルギー・免疫. 2012; 19(11):1770-1782



目次へ戻る

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

安全性

【質問】

ディレグラ配合錠の禁忌として「重症の高血圧の患者」とあるが、その目安を教えてください。

【回答】

重症の高血圧患者の定義は、日本高血圧学会の高血圧治療ガイドライン¹⁾をご参照ください。

Ⅲ度高血圧 収縮期血圧 $\geq 180\text{mmHg}$ または拡張期血圧 $\geq 110\text{mmHg}$

参考資料

1) 高血圧治療ガイドライン

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

投与期間

【質問】

ディレグラ配合錠は長期処方が可能ですか。

【回答】

ディレグラ配合錠は投与期間に上限が設定されている薬剤ではありませんが、本剤の添付文書には、「本剤の使用により効果が認められない場合には、漠然と長期にわたり投与しないよう注意すること¹⁾」と記載されております。

そのため、投与中は患者の鼻炎症状(特に鼻閉症状)や重症度の変化に注意し、適正にご使用頂くようお願いいたします。

なお、承認時までの臨床試験では、2週間を超えて本剤を投与したときの有効性・安全性は検討されていませんでした¹⁾が、市販後調査として観察期間が8週間の使用成績調査を行った結果、安全性では投与2週間以降に遅発性の副作用および副作用発現頻度の増加は認められませんでした²⁾。また、有効性では投与2週間以降も効果の減弱はみられませんでした。

保険請求に関しては、各地域の審査支払機関等に確認していただくようお願いいたします。

ディレグラ配合錠 添付文書(抜粋)

8. 重要な基本的注意

8. 1 本剤の使用は鼻閉症状が強い期間のみの最小限の期間にとどめ、鼻閉症状の緩解がみられた場合には、速やかに抗ヒスタミン剤単独療法等への切り替えを考慮すること。本剤を2週間を超えて投与したときの有効性及び安全性は臨床試験では検討されていない。2週を超えて投与する場合には患者の症状を確認しながら投与すること。[5.、17. 1. 1 参照]

8. 2 効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

参考資料

1)ディレグラ配合錠 添付文書 8. 重要な基本的注意

2)ディレグラ配合錠 インタビューフォーム V. 治療に関する項目 2)安全性試験 (6)治療的使用

1)使用成績書調査(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、

製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容



目次へ戻る

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

その他

【質問】

ディレグラ配合錠はドーピングの禁止物質に該当しますか。

【回答】

ディレグラ配合錠の有効成分のうち、塩酸プソイドエフェドリンは一部規制に該当します¹⁾。

競技会期間中の薬物治療については、競技者が事前に医師に相談し、別の許可された医薬品を処方してもらうか、あるいは事前に治療使用特例(TUE)の申請を行うことで使用が認められる場合があります。詳しくは日本アンチ・ドーピング機構にお問い合わせください。

参考資料

1)2022 禁止表国際基準 公益財団法人 日本アンチ・ドーピング機構

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

用法・用量

【質問】

適宜増減の記載がないが、増量、減量が可能ですか。

【回答】

ディレグラ配合錠の用法及び用量には適宜増減の記載はありません。

ディレグラ配合錠を増量して投与した場合の有効性・安全性データはなく、ディレグラ配合錠は増量しないようお願いします。なお、添付文書の 9. 2 腎機能障害患者では適宜減量するよう記載されています。

ディレグラ配合錠 インタビューフォーム

9. 2 腎障害患者

適宜減量すること。塩酸プソイドエフェドリンは主として腎臓を経て尿中に排泄され、腎機能障害患者では排泄が遅延し、作用が強くなるおそれがある。[16.5、16.6.1 参照]

(解説)

プソイドエフェドリンの経口投与時にその大部分が尿中に未変化体として排泄(43~96%)されたとの報告¹⁾(「VII. 7. 排泄」の項参照)があることから、腎機能が低下することにより、プソイドエフェドリンのクリアランスが低下するおそれがある。そのため、プソイドエフェドリンの消失半減期の延長や蓄積が起こりプソイドエフェドリンの作用が強くなるおそれがある。なお、腎機能障害のある患者でのプソイドエフェドリンの薬物動態データはない。

参考資料

1) Kanfer I, et al.: Pharmacotherapy. 1993; 13(6 Pt2): 116S-128S



目次へ戻る

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

安全性

【質問】

ディレグラ配合錠は抗コリン作用がありますか。

【回答】

ディレグラ配合錠は以下の理由により抗コリン作用自体はないと考えられます。

フェキソフェナジン塩酸塩についてはムスカリン受容体に対する親和性は極めて低く、モルモット
摘出回腸のアセチルコリン収縮を抑制しないことから、抗コリン作用は有さないと考えられます¹⁾。

また、塩酸プソイドエフェドリンは交感神経刺激薬(アドレナリン作動薬)であり、抗コリン作用は
ありません。

しかし、交感神経の刺激作用に伴い、相対的に副交感神経が抑制される現象がみられる可能性
があると考えられます。

参考資料

1) ディレグラ配合錠 インタビューフォーム VI. 薬効薬理に関する項目 2. 薬理作用



【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

製剤

【質問】

殻錠(ゴーストタブレット)が排泄されるとあるが、どのようなものですか。

【回答】

糞便中に排泄されるのは、「有効成分放出後の殻錠」です。

参考資料

ディレグラ配合錠 インタビューフォーム VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

14. 適用上の注意

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

製剤

【質問】

殻錠の成分、および色、形、大きさ、硬さを教えてください。

【回答】

錠剤の添加剤として使われているカルナウバロウは天然ロウの中でもっとも硬く、かつ融点も80～86℃と高く¹⁾、また水にもほとんど溶けないため、体内で有効成分が放出された後、カルナウバロウ自体は形を保ったまま殻錠として排泄されます。
なお、実際に排泄された殻錠を回収しての測定は行っておりません。

ディレグラ配合錠 インタビューフォーム VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

14. 適用上の注意

・糞便中に、有効成分放出後の殻錠が排泄されることがある。

(解説)

・本剤は服用後ほとんど変形せず、糞便中に排出されることがある錠剤である。

●患者向け資材「ディレグラ配合錠を服用される方へ」

「ディレグラ配合錠は1剤で3症状を改善するお薬です」

ここもチェック 殻錠が出ることがあります

このお薬の「抜け殻」が便の中に出ることがあります。
これは、お薬の成分が体内で吸収されたあとの残りです。
成分はきちんと吸収されています。効果に影響はありませんので、ご安心ください。



参考資料

1)厚生労働省 第9版 食品添加物公定書

<https://www.mhlw.go.jp/file/06-Seisakujouhou-11130500-Shokuhinzenbu/0000192874.pdf#page=548>



[目次へ戻る](#)

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

製剤

【質問】

殻錠が出る頻度を教えてください。

【回答】

頻度は不明ですが、殻錠は水に溶けない成分で構成されておりますので、通常、糞便と共に体外に排出されると考えられます。

参考資料

ディレグラ配合錠 インタビューフォーム VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

14. 適用上の注意



目次へ戻る

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

製剤

【質問】

適用上の注意に、「本剤は徐放層を含む錠剤」と記載されていますが、これはどのようなことですか。

【回答】

本錠剤は一部の有効成分が徐々に溶け出すよう設計されていることを示しています。そのため、錠剤を割ったり、磨り潰したりすると、徐々に溶け出すように設計されたものが正しく機能せず、体内での薬物濃度が通常に服用した場合に比べて早い時間に高い濃度になり、予期しない有害な作用が生じたり、効果が期待したとおりに発揮されなくなる可能性があるため、錠剤はそのまま服用してください。

参考資料

ディレグラ配合錠 インタビューフォーム VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

14. 適用上の注意

【製品名】

ディレグラ配合錠

【分類】

臨床

【質問】

食前・食後投与の臨床効果を比較した報告がありますか。

【回答】

ディレグラ配合錠を食前または食後に投与して、臨床効果を比較検討した報告はございません。
用法及び用量通り、朝および夕の空腹時に服用頂きますようお願いいたします。

[参考]

ディレグラ配合錠 添付文書

6. 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60mg及び塩酸
プソイドエフェドリンとして120mg)を1日2回、朝及び夕の空腹時に経口投与する。

●ディレグラ配合錠は、食事の影響を検討した国内第I相試験において、空腹時に比べ食後服用
では血漿中フェキソフェナジン濃度が大きく低下することが確認されています。

※食事の影響^{1,2)}

日本人健康成人男子にディレグラ配合錠2錠を単回経口投与したとき、絶食時に対する食後
投与時の血漿中プソイドエフェドリンの C_{max} 及び AUC_{0-72} の幾何平均比の90%両側信頼区間は
それぞれ0.96~1.10及び0.90~1.00であったのに対し、血漿中フェキソフェナジンではそれぞれ
0.29~0.43及び0.33~0.43であった。

なお食事の影響を検討した国内第I相試験の結果から国内臨床試験(PhaseII/III)は空腹時投与
で実施しており、食後服用時の臨床試験は行われておりません。

参考資料

- 1)【ALI11251試験】FEX/PSE 配合錠の第I相臨床試験(食事の影響および安全性の検討)
(2012年12月25日承認、CTD2.7.6.2)
- 2)インタビューフォーム VII. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移