

片頭痛の急性期治療薬（5-HT1F 受容体作動薬）

2022年6月、片頭痛の急性期治療薬のレイボー錠（一般名：ラスミジタンコハク酸塩）が発売されました。世界初の選択的セロトニン（5-HT）1F 受容体作動薬（ジタン系薬）で、トリプタンとは別の 5-HT 受容体に結合し、トリプタンが使えないアンメット・メディカル・ニーズを満たす可能性があります。

片頭痛の急性期治療薬には、①アセトアミノフェン、②NSAIDs、☒トリプタン、④エルゴタミン、⑤制吐薬などがあり、重症度に応じて使い分けられます。片頭痛の病態は、中枢での疼痛シグナル伝達、及び末梢での三叉神経系の過活動が関与するとされ、5-HT1F 受容体との関連性が指摘されてきました。トリプタンは、5-HT1B/1D 受容体作動薬で、血管平滑筋にある 5-HT1B 受容体を介する血管収縮と三叉神経に存在する 5-HT1 D 受容体を介して、カルシトニン遺伝子関連ペプチド（CGRP）やグルタミン酸などの炎症性ペプチドの放出を抑制し、発作を頓挫させます。2000年のトリプタンの登場により、片頭痛治療は大きく前進しました。しかし、発作から 20～30分以内の服用（早過ぎ・遅過ぎの場合は、効果なし）という服用タイミングの難しさがあります。さらに、トリプタンが効かないノンレスポnderや、血管収縮作用のために使えない虚血性心疾患などが存在します。レイボーは、5-HT1F 受容体に選択的に結合することにより、中枢での疼痛情報の伝達を抑制し、神経原性炎症に関わる三叉神経からの CGRP 放出を抑制します。5-HT1B 受容体への親和性は低く、非臨床試験では血管収縮作用を示しませんでした。そのため心血管系に危険因子をもつ患者の急性期治療薬として期待されます。また、レイボーは、服用タイミングに影響されにくく、臨床試験において、発作後 1 時間未満に服用した場合も、1 時間以降に服薬した場合も、服用 2 時間後に頭痛が改善しました。ただし、「予防目的で使用しない」、「24 時間以内の総投与量が 200mg を超えない」などの注意があります。低分子（分子量：872.81）、脂溶性（分配係数：2.97）で、血液 - 脳関門を通過します。浮動性めまいや傾眠など、中枢系副作用が用量依存的に発現します。ほとんどは軽度から中等度で、1 時間以内に現れ、数時間以内に消失しますが、自動車運転を控えること、めまい・傾眠による高齢者の転倒には注意が必要です。

商品名	レイボー錠 50mg、100mg
一般名	ラスミジタンコハク酸塩
会社名	リリー／第一三共
適応症	片頭痛
用法用量	通常、成人にはラスミジタンとして 1 回 100mg を片頭痛発作時に経口投与する。ただし、患者の状態に応じて 1 回 50mg 又は 200mg を投与することができる
関連する注意	片頭痛発作時のみに使用し、予防的に使用しないこと 全く効果が認められない場合は、その発作に対して追加投与しないこと
重要な基本的注意	眠気、めまい等があらわれることがあるので、 本剤投与中は自動車の運転等をしないこと
妊婦	治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること(有益性投与)
小児	小児等を対象とした臨床試験は実施していない
副作用	浮動性めまい、動悸、回転性めまい、悪心、疲労(無力症を含む)、異常感(ゆったり感、酩酊感を含む)、筋力低下、嗜眠(倦怠感、不快感を含む)、錯覚、傾眠(鎮静、過眠症を含む)、感覚鈍麻、協調運動障害(歩行障害、不器用等を含む)
薬価	50 mg 324.70 円、100 mg 570.90 円

使用に際しては、添付文書を必ずお読み下さい。

急性期治療薬エビデンスサマリ：薬効の group が 1（有効）の薬

薬 剤	推奨の強さ	エビデンスの確実性	薬効の group
ジタン系			
スマトリプタン（イミグラン）	強い	A	1
ゾルミトリプタン（ゾーミック）	強い	A	1
エレクトリプタン（レルボックス）	強い	A	1
リザトリプタン（マクサルト）	強い	A	1
ナラトリプタン（アマージ）	強い	A	1
ジタン系			
ラスミジタン（レイボー）		A	1

頭痛の診療ガイドライン 2021 を改変