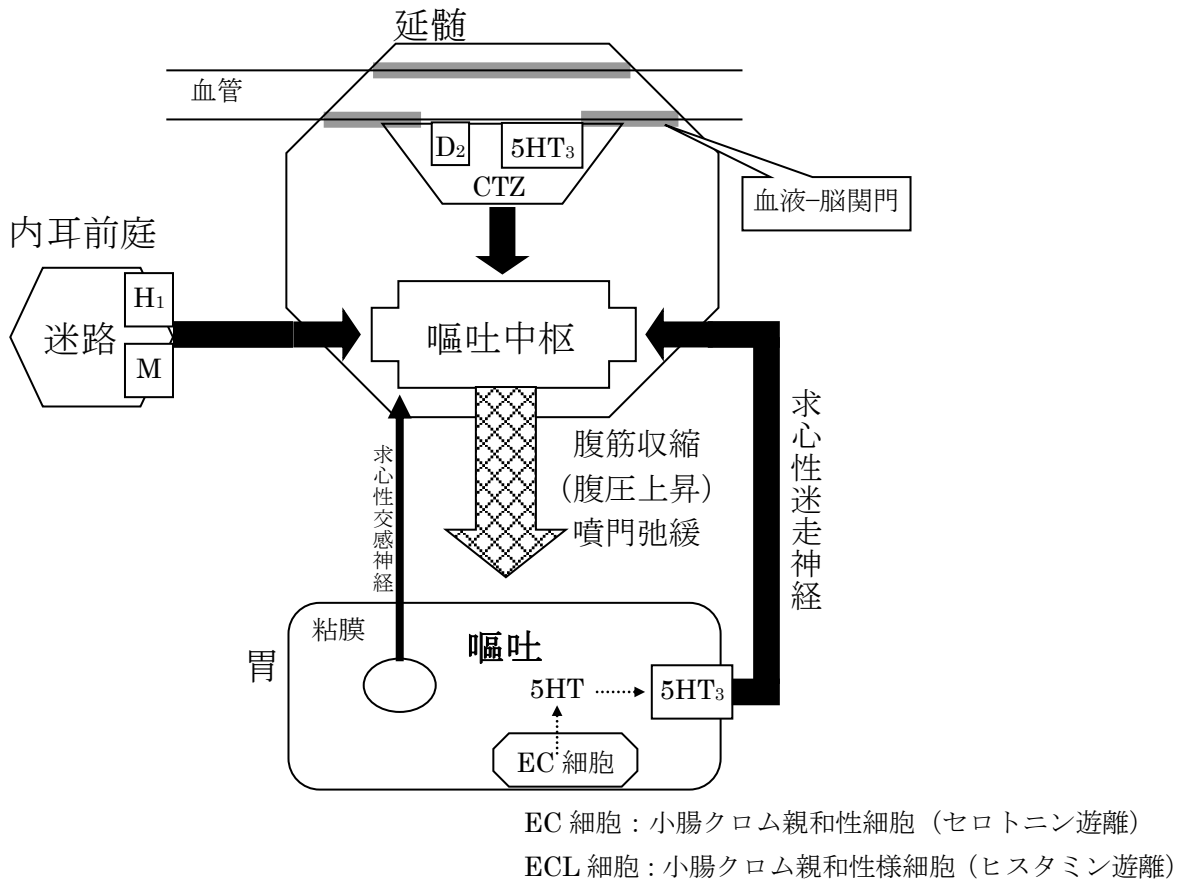


消化器系作用薬「制吐薬」

「嘔吐発現の機構（主要経路の概念図）」



1 ドパミン D₂ 受容体遮断薬：クロルプロマジン、ドンペリドン、メトクロプラミド、スルピリド

- ① CTZ の D₂ 受容体を遮断して嘔吐を抑制する。
- ② 乗物酔いには無効。

2 末梢性制吐薬：オキセサゼイン、アミノ安息香酸エチル

- ① 局所麻酔作用により胃粘膜の刺激による反射的嘔吐を抑制。
- ② オキセサゼインは G 細胞のガストリン遊離抑制（胃酸分泌抑制）。

3 抗動揺病(乗物酔)薬

1) ヒスタミン H₁ 受容体遮断薬：ジメンヒドリナート、プロメタジン

- ① 内耳前庭・迷路のヒスタミン H₁ 受容体を遮断。
- ② 気分の高揚を目的としてキサンチン類(カフェイン、テオフィリン等)を配合することがある。
- ③ ジメンヒドリナートは、ジフェンヒドラミン(H₁遮断薬)の 8-クロルテオフィリン塩。

2) 抗コリン薬：スコポラミン

- ① 内耳前庭・迷路のムスカリン(M)受容体を遮断。
- ② 胃弛緩+胃液分泌抑制（末梢作用）。

4 セロトニン 5-HT₃受容体遮断薬：

グラニセトロン、オンダンセトロン、パロノセトロン、アザセトロン、ラモセトロン

- ① CTZ および消化管粘膜の 5-HT₃受容体を遮断
- ② シスプラチンなどの抗がん剤による急性の悪心・嘔吐に有効
*急性嘔吐：投与後 1~2 時間で発現。24 時間以内に改善
- ③グラニセトロンは、放射線照射に伴う悪心・嘔吐にも用いられる。

5 タキキニン NK₁受容体遮断薬：アプレピタント

- ① CTZ などのタキキニン NK₁ (ニューロキニン 1)受容体を遮断
- ② シスプラチンなどの抗がん剤による急性および遅発性の悪心・嘔吐に有効
*遅発性嘔吐：投与後 24 時間以降に発現。
サブスタンス P→NK₁受容体刺激→遅発性嘔吐

6 その他

- * 抗がん剤治療の予測性悪心・嘔吐には、ベンゾジアゼピン系抗不安薬のロラゼパムやアルプラゾラムが用いられる。

「確認問題」

- () アポモルヒネは、胃粘膜を刺激して反射的に嘔吐を引き起こす。
- () 硫酸銅は、延髄 CTZ のドパミン D₂受容体を刺激して嘔吐を引き起こす。
- () トコン (吐根) は、有効成分のエメチンやセフェリンが嘔吐を引き起こす。
- () ドンペリドン は、延髄 CTZ のドパミン D₂受容体を遮断して嘔吐を抑制する。
- () メトクロプラミドは、乗り物酔いによる悪心・嘔吐にも有効である。
- () プロメタジン は、内耳前庭・迷路のヒスタミン H₁受容体を遮断して、乗り物酔いによる悪心・嘔吐を抑制する。
- () オキセサゼインは、局所麻酔作用により胃粘膜の刺激による反射的嘔吐を抑制する。
- () オンダンセトロンは、セロトニン 5-HT₃受容体遮断薬であり、抗がん剤による遅発性の悪心・嘔吐に有効である。
- () アプレピタントは、タキキニン NK₁受容体遮断薬であり、抗がん剤による急性および遅発性の悪心・嘔吐に有効である。
- () アザセトロンは、抗がん剤治療の予測性悪心・嘔吐に有効である。
- () グラニセトロンは、放射線照射に伴う悪心・嘔吐に用いられる。