

### C. 筋小胞体からの $\text{Ca}^{2+}$ 遊離を抑制する薬物

薬物名	作用機序・特徴
ダントロレン	興奮-収縮連関抑制薬 リアノジン受容体に結合 → 筋小胞体からの $\text{Ca}^{2+}$ 遊離抑制 (適応) 痙攣性麻痺、悪性高熱症、悪性症候群

### D. その他

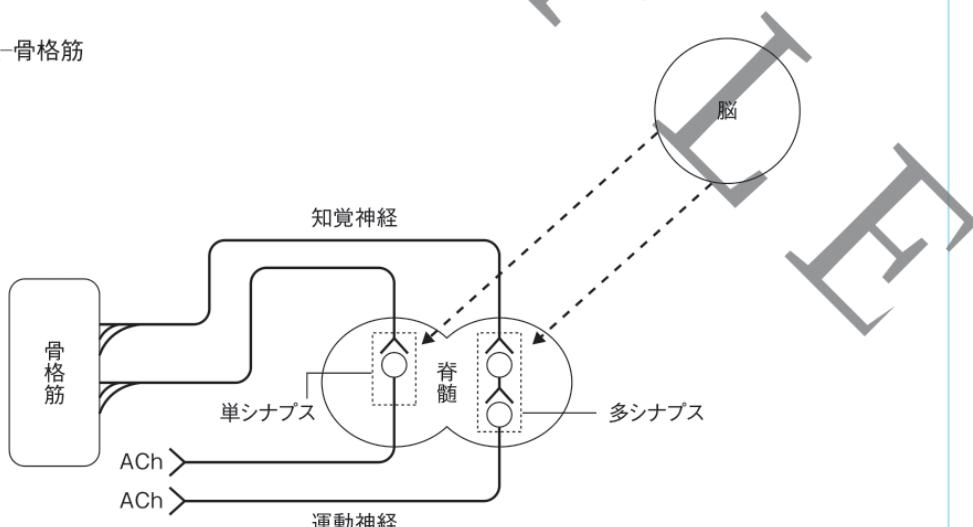
薬物名	作用機序・特徴
テトロドトキシン*	運動神経の $\text{Na}^+$ チャネル遮断 → ACh 遊離抑制
A型ボツリヌス毒素	運動神経終末からの ACh 遊離抑制 (適応) 眼瞼痙攣
$\text{Mg}^{2+}$	$\text{Ca}^{2+}$ の代わりに運動神経終末へ流入 → ACh 遊離抑制
ヘミコリニウム*	コリンの取込み阻害 → ACh 合成阻害

\* 現在適応なし。

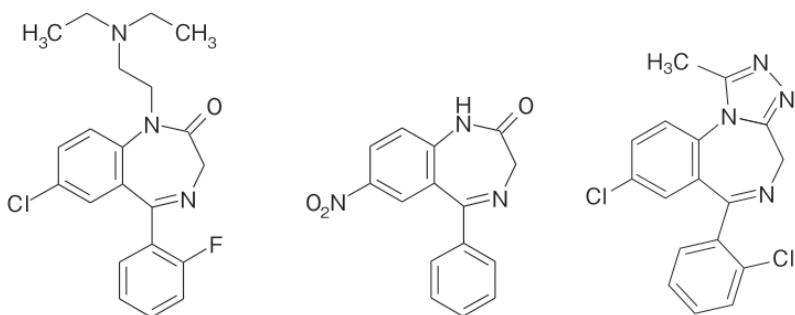
### ■ 2.2.3 中枢性筋弛緩薬

分類	薬物名	特徴
多シナプス反射抑制薬	クロルフェネシン	多シナプス反射経路の介在ニューロンを選択的に遮断
多シナプス反射・单シナップス反射抑制薬	チザニジン	アドレナリン $\alpha_2$ 受容体刺激作用
	バクロフェン	$\text{GABA}_B$ 受容体刺激作用

#### 中枢神経-骨格筋



## B. ベンゾジアゼピン(BZ)系薬



長時間型：フルラゼパム

中間型：ニトラゼパム

超短時間型：トリアゾラム

薬理作用	催眠作用：視床下部～大脳辺縁系を抑制(REM睡眠の抑制作用が弱い) 抗不安作用、催眠作用、筋弛緩作用、抗痙攣作用
急性中毒	呼吸抑制(呼吸中枢抑制) → <b>フルマゼニル</b> (ベンゾジアゼピン結合部位遮断薬)で解毒
慢性中毒	精神・身体依存、耐性(長期間、大量の連用で起こる)
副作用	・前向性健忘、反跳性不眠(短時間型、超短時間型で起こりやすい) ・持ち越し効果(長時間型で起こりやすい)
禁忌	重症筋無力症、急性狭角角緑内障

## C. 非ベンゾジアゼピン(BZ)系薬

薬物	特徴
〈超短時間型〉 ゾピクロン ゾルピデム	・ベンゾジアゼピン系薬と化学構造が異なるが、ベンゾジアゼピン結合部位に結合し、GABA <sub>A</sub> 受容体機能を亢進する ・ゾピクロンは、α <sub>1</sub> 、α <sub>2</sub> 、α <sub>3</sub> 又はα <sub>5</sub> サブユニット <sup>*1</sup> とγサブユニットから成るBZ結合部位に非選択的に作用する ・ゾルピデムは、α <sub>1</sub> サブユニットとγサブユニットから成るBZ結合部位に選択的に作用するため、ゾピクロンに比べて筋弛緩作用が弱い

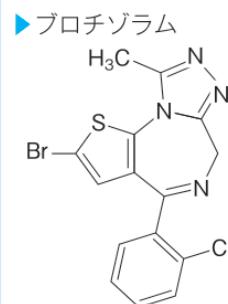
## D. その他の催眠薬

## a. ラメルテオン(超短時間型)

メラトニンMT<sub>1</sub>, MT<sub>2</sub>受容体<sup>\*2</sup>刺激 → 睡眠覚醒リズムの調節。

## b. スポレキサント(中間型)

オレキシン<sup>\*3</sup>OX<sub>1</sub>, OX<sub>2</sub>受容体遮断



チエノジアゼピン誘導体。BZ系薬に分類され、短時間型である。

▶\*1 α<sub>1</sub>サブユニットを含むBZ結合部位をω<sub>1</sub>受容体、α<sub>2</sub>やα<sub>3</sub>、α<sub>5</sub>サブユニットを含むBZ結合部位をω<sub>2</sub>受容体とよぶこともあるが、現在はサブユニットの表記が一般的である。

▶\*2 メラトニンMT<sub>1</sub>受容体の刺激は、神経興奮の抑制や体温を下降させ、睡眠を誘発する。メラトニンMT<sub>2</sub>受容体の刺激は、体内時計を同調させ概日リズム(サークルディアンリズム)の位相を変動させる。

▶\*3 オレキシンは、脳幹と視床下部のモノアミン作動性神経機能を亢進し、大脳皮質へ興奮性の影響を与え、覚醒の維持に関与する。

## Exercise 1

1 w/v% プロカイン塩酸塩点眼液 100 mL を涙液と等張にするために加えるべき塩化ナトリウムの量(g)を求めよ。ただし、1 w/v% プロカイン塩酸塩溶液と 1 w/v% 塩化ナトリウム溶液の氷点降下度は、それぞれ 0.122°C と 0.58°C である。

【解答】 0.69 g

【解説】

医薬品の数は 2 つだから

$$ax + by = 0.52$$

ここで 1 w/v% プロカイン塩酸塩溶液  $x$  の氷点降下度(a)は 0.122°C である。

求める塩化ナトリウムの濃度  $y$  は、

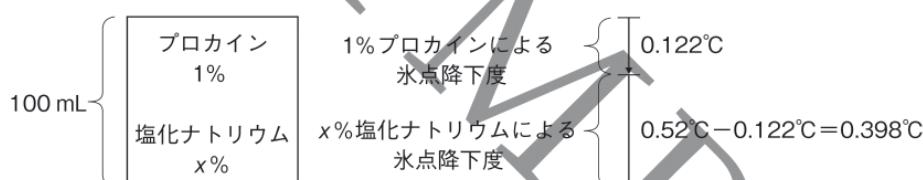
$$\therefore 0.122 \times 1 + 0.58 \times y = 0.52$$

$$y \doteq 0.69(\text{w/v\%})$$

$$= 0.69 \text{ g}/100 \text{ mL}$$

したがって、0.69 g の塩化ナトリウムを加えればよい。

【別解】



添加すべき塩化ナトリウムの量は、以下のように求めることができる。

$$1\% : 0.58^\circ\text{C} = x\% : 0.398^\circ\text{C}$$

$$x \doteq 0.69(\text{w/v\%}) = 0.69 \text{ g}/100 \text{ mL}$$

### b. 食塩当量法(食塩価法)

ある医薬品の 1 g と同じ浸透圧を示す塩化ナトリウムの g 数をその医薬品の **食塩当量** という。塩化ナトリウムの 0.9 w/v% 水溶液が血清や涙液と等張であるから、次式を用いて等張化剤の量を計算する。

$$x = 0.9 - a$$

$x$  : 加えるべき塩化ナトリウムの量(g)

$a$  : 医薬品の食塩当量