

あたらしい薬 (18)

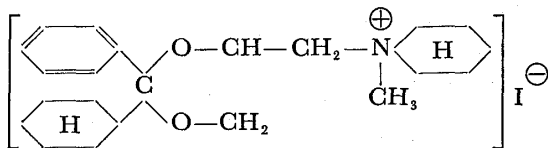
担当: 村山 智*

鎮 痙 薬

一般名: ヨウ化シクロニウム

商品名: エスペラン

化学構造式:



N-Methyl-N-(2-cyclohexyl-2-phenyl-1,3-dioxolan-4-ylmethyl) piperidinium iodide

(富山化学)

すでに数多くの鎮痙薬が臨床的に用いられており、作用の面からは特にとりあげるべきあたらしい点はないとも言えるが、従来の鎮痙薬の多くがアトロピン類似の化学構造をもっているのに対し、本薬物は 1,3-dioxolane 系化合物に属していることが特徴といえる。この系列の化合物は今から 20 数年前に Fourneau らにより注目されはじめ、わが国においてもそのうちの 하나가アナコリンの名で 1955 年に発売された。ヨウ化シクロニウム (エスペラン) は富山大学の木村正康教授と富山化学工業 K. K. の総合研究所との共同開発になるあたらしいアトロピン様作用物質として 1964 年に登場し本年に至るまで研究調査がくりかえされて来たものである。

理化学的性質: 本薬物は白色結晶性粉末で苦味があるが特においはなく、水にとけにくい。融点 198~203°C と報告されている。本薬物は直射日光照射試験により含量変化がみとめられたことより錠剤は遮光、気密容器に入れ、注射液は着色容器に貯蔵することが必要である。

薬理作用: 木村, 平井, 高井による第 1 報 (日薬理誌 61, 23 §, 1965) 以来一連の研究報告があるがとくにその第 4 報 (応用薬理 2, 33~41, 1968) および英文による報告 (Jap. J. Pharmacol., 18, 218~223, 1968) な

どを中心にその薬理作用をまとめると次のようになる。マウスの摘出小腸, ラットの摘出胃およびモルモットの生体小腸などについての実験では本薬物はほぼ硫酸アトロピンの効果に類似する。マウスの小腸における炭末移送能においてはアトロピンの効力の 3 倍以上を示した。本薬物はアトロピンと同様にコリン作動受容器においてアセチルコリンと競合することにより鎮痙作用をあらわすとみられる。Shay rat による胃潰瘍, セロトニン胃潰瘍についてアトロピンよりやや強い抗潰瘍効果を示し、ブタの摘出胆管標本にて胆管および Oddi 氏筋の弛緩をおこした。他の抗コリン剤とややことなり、本薬物が示す胆汁排泄促進効果は塩酸パパベリンの約 4% の効力を示した。本薬物がアトロピンとややことなる点は、散瞳作用がアトロピンの約 1/10, 唾液分泌抑制効果がアトロピンの約 1/20 以下とみられることであり、これは臨床上口渇の度が他の鎮痙薬に比べるとすくない原因とみられる。この薬物は別にかかなり強い局所麻酔作用を示すが、普通の鎮痛作用はない。なお抗ヒスタミン作用はほとんどみとめられない。

吸収および排泄: 本薬物が経口応用で比較的良好に吸収されるのはその高い脂溶性によるとみられ、胃からも吸収されるとみられている。胃, 腸, 膀胱などの平滑筋組織によく分布し、脳にはほとんど分布がみられない。胆汁への排泄はむしろ尿中排泄を上回り、しかもそのままの形で排泄されるものが多い。

副作用: 臨床例の約 15% に口渇がみられるが比較的軽度であり、その他の副作用はすくないとされている。

適応, 用法および用量: 胃腸管, 胆管, 尿路, 女性々器などの痙れんによる痛みに対し、経口投与 1 日量 30~60mg, 皮下, 筋肉または静脈注射では 1 回 10~20mg とされる。

(1970. 12. 9 受付)

* 千葉大学医学部薬理学教室・教授