

あたらしい薬 (10)

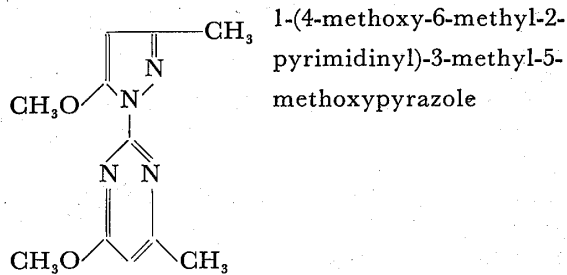
担当：村山 智*

—非ステロイド消炎剤—

一般名：メトピリマゾール (Metopyrimazole)

商品名：メブロン (Mebron)

化学構造式：



(第一製薬)

古くからアンチピリン、アミノピリン、スルピリンなどの下熱鎮痛薬が用いられてきたが、その系列の上にはフェニールブタゾンにみられるように消炎作用の強いものがあることがわかって以来、いわゆる非ステロイド性の消炎剤の研究が促進された。ここにとりあげたメトピリマゾール(メブロン)は第一製薬研究所において合成された薬物で、アミノピリンよりもすぐれた鎮痛作用を示し、オキシフェンブタゾンよりも強力な消炎作用をもつことで注目された。

理化学的性質：本物質は水にやや溶け難く、白色または微黄色の結晶(または結晶性粉末)で特異な臭いおよび苦味がある。融点 87.5~89.0°C であり、酸、アルカリに安定な化合物である。粉末状態で最長 2 年、80°C および 50°C (遮光下) にて 2 カ月、太陽光線あるいは紫外線曝光 2 カ月などの処置によりほとんど変化がみられなかったと報告されている。

薬理作用：本物質の薬理作用については秋元たち(日本薬理学雑誌 65, 378~409, 1969)が詳細に報告しているが、その鎮痛効果はマウスの各種試験を総合するとアミ

ノピリンと同等あるいはそれ以上の力価を示し、その効果持続も同等であった。各種薬物により誘起したラットの実験的浮腫に対して著明な抑制作用を示したが、実験的肉芽腫抑制作用は微弱であった。消炎作用と下垂体—副腎系との関係をみるために、下垂体摘出ラット、副腎摘出ラットなどを用いて検討した結果では、この系の関与はあまり重要な因子とならないとみられる。なお毛細血管透過性の抑制作用はアミノピリンよりやや劣る。また発熱ウサギにおける下熱作用はアミノピリンの約 1/2 であったという。本物質はバルビツール酸誘導体による睡眠時間を延長したり、抗けいれん作用を示したりして中枢抑制作用をあきらかに示すが、脳波学的検索からは、脳幹網様体の上行賦活系の活動を抑制することが考えられる。摘出腸管標本における実験では各種腸管収縮薬に対し、パパベリン様の拮抗作用を示した。

吸収および排泄：ラット、マウス、ウサギ、イヌに経口投与したときの最高血中濃度はいずれも 15~60 分にとめられた。ラットに経口投与したさいの尿中排泄をみると、8 時間後に約 50%、48 時間後に約 75% が排泄され、おもな経路が泌尿器系にあることがわかる。

副作用：約 6% にみられたが、おもなものは食慾不振、嘔吐などの消化器系の症状であった。

適応、用法および用量：手術後や外傷後の消炎、鎮痛に用いられ、また次のような疾患の消炎、鎮痛にも適用される。急性上気道炎、頸肩腕症候群、腰痛症、関節症、神経痛、膀胱炎、子宮附属器炎、抜歯、智歯周囲炎、歯髄炎など。投与量は 1 日 150~450 mg を 2~4 回に分けて用いるが年齢、症状に応じて適宜増減が可能である。なお臨床試験においては少数例をのぞきほとんど食事直後に服用させたと報告されている。

(昭 45. 6. 20 受付)

* 千葉大学医学部薬理学教室・助教授