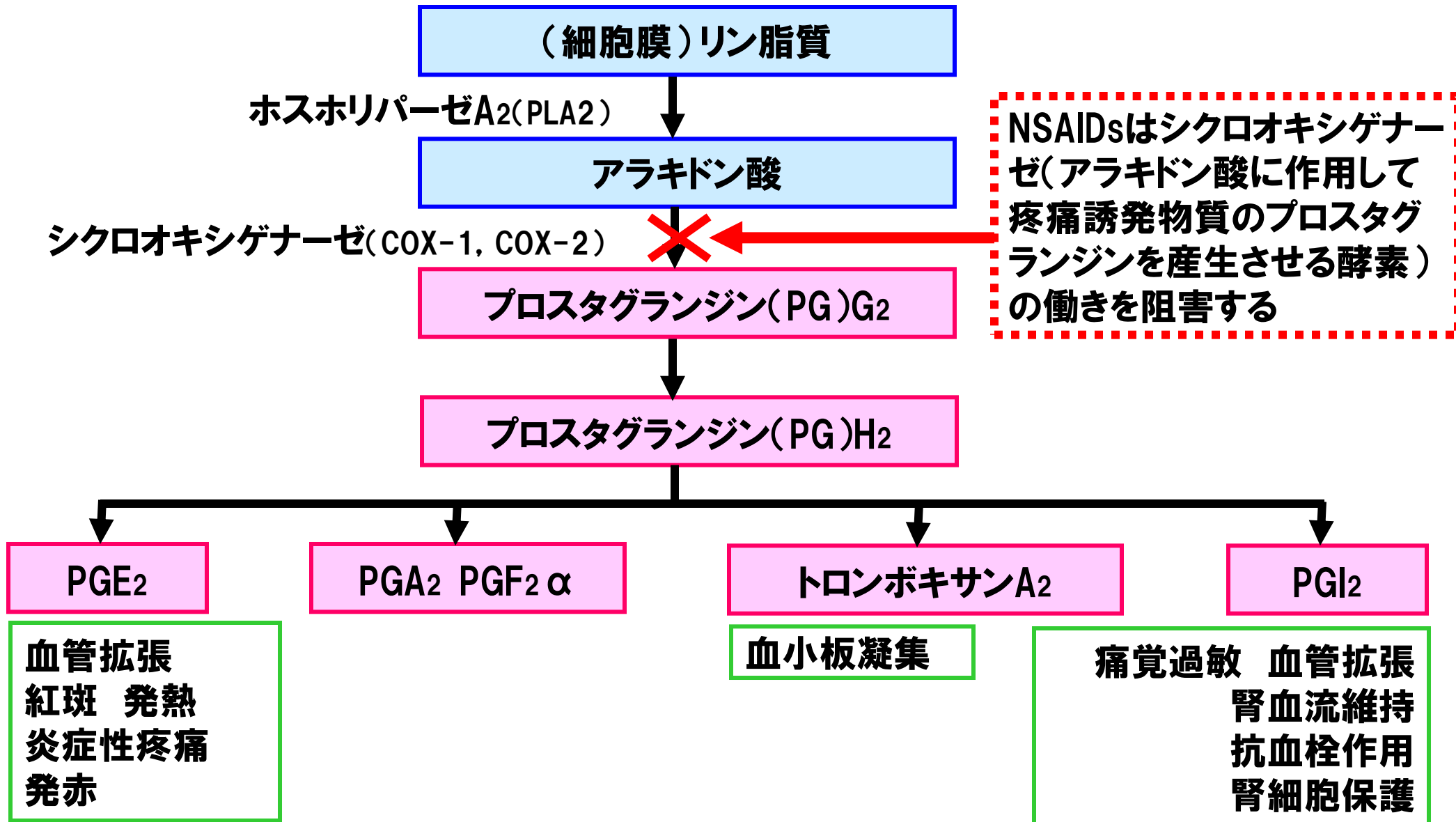


# **【非オピオイド鎮痛薬】**

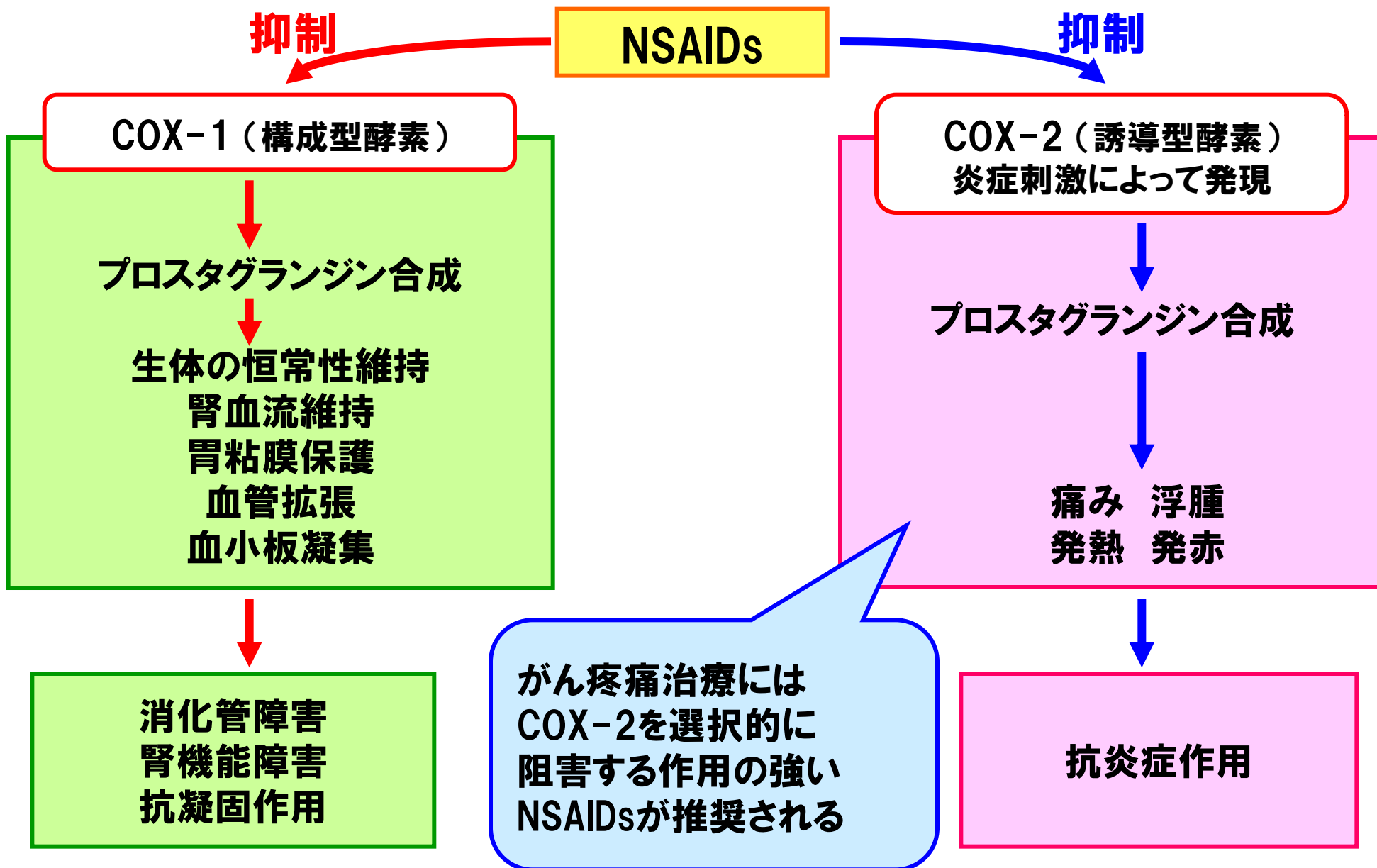
**非ステロイド性鎮痛薬(NSAIDs)**

**アセトアミノフェン**

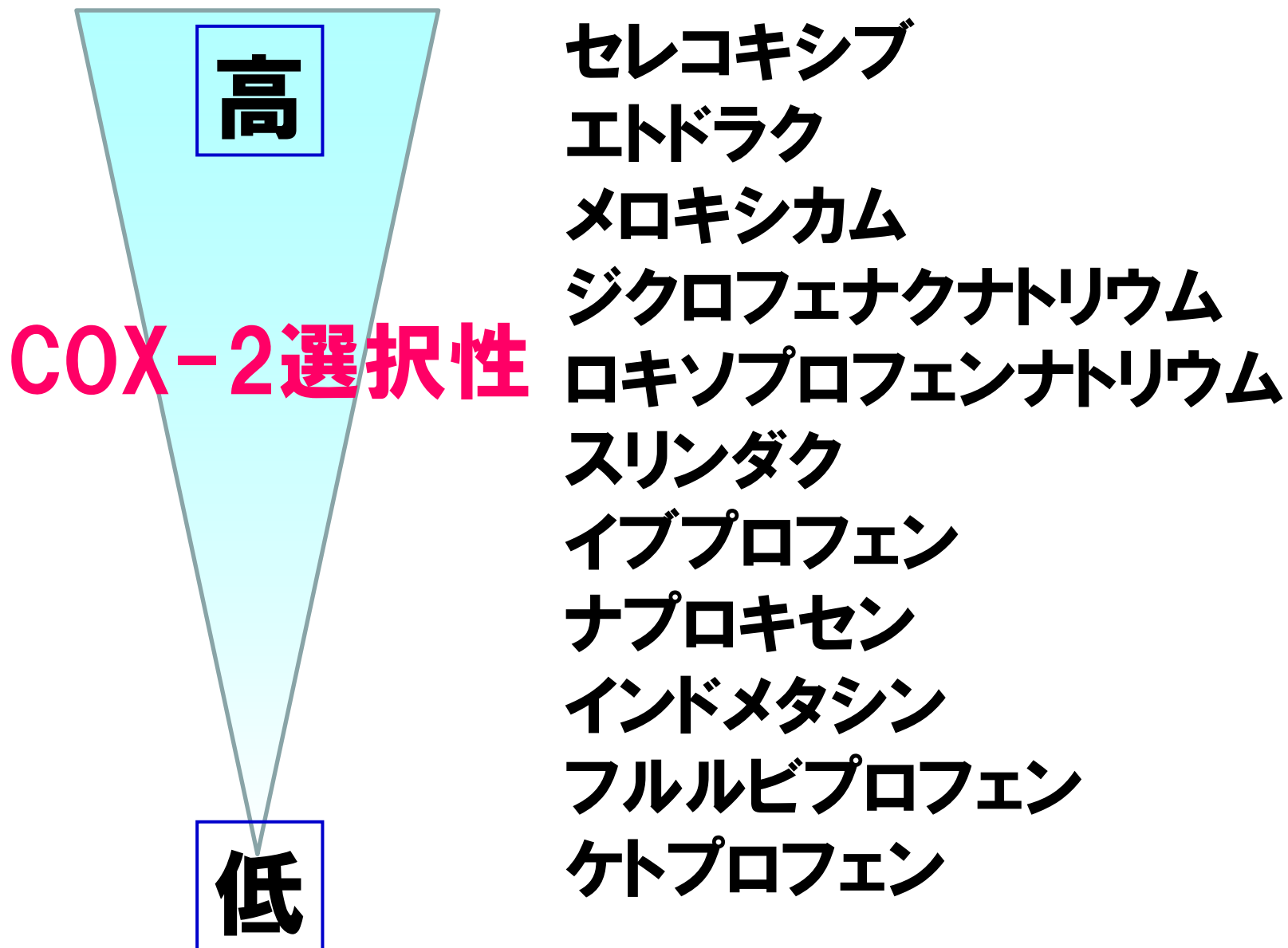
# 非ステロイド性鎮痛薬(NSAIDs)の作用点



# COX-1、COX-2の薬理作用



# 主なNSAIDsのCOX-2選択性



# NSAIDsの血中半減期による分類

|      | 一般名           | (例)商品名              | 血中半減期<br>(時間) | 用法   |
|------|---------------|---------------------|---------------|------|
| 短時間型 | ジクロフェナクナトリウム  | ボルタレン <sup>®</sup>  | 1.3           | 1日3回 |
|      | ロキソプロフェンナトリウム | ロキソニン <sup>®</sup>  | 1.3           | 1日3回 |
|      | イブプロフェン       | ブルフェン <sup>®</sup>  | 2             | 1日3回 |
|      | ロルノキシカム       | ロルカム <sup>®</sup>   | 2.5           | 1日3回 |
| 中間型  | セレコキシブ        | セレコックス <sup>®</sup> | 7             | 1日2回 |
|      | エトドラク         | ハイペン <sup>®</sup>   | 7             | 1日2回 |
|      | ザルトプロフェン      | ソレトン <sup>®</sup>   | 9             | 1日2回 |
|      | スリンダク         | クリノリル <sup>®</sup>  | 18            | 1日2回 |
| 長時間型 | ナブメトン         | レリフェン <sup>®</sup>  | 21            | 1日1回 |
|      | メロキシカム        | モービック <sup>®</sup>  | 28            | 1日1回 |

# NSAIDsの剤型と特徴

|       | 剤型                  | 特徴                        | (例)商品名                   |
|-------|---------------------|---------------------------|--------------------------|
| 経口剤   | 徐放剤                 | 効果持続                      | ボルタレンSR®カプセルなど           |
|       | プロドラック              | 胃腸障害軽減                    | ロキソニン®錠<br>クリノール®錠など     |
|       | 坐剤                  | 即効性、胃腸障害軽減                | ボルタレン®坐剤<br>インドメタシン®坐剤など |
|       | 注射剤                 | 病変部位での作用増強                | ロピオン®注など                 |
| 経皮吸収剤 | 軟膏剤<br>(クリーム、ゲル剤含む) | 全身性の副作用軽減<br>マッサージ効果      | ボルタレン®ゲル<br>インテバン®クリームなど |
|       | 貼付剤                 | 全身性の副作用軽減<br>皮膚のかぶれ、光線過敏症 | モーラス®テープ<br>アドフィード®など    |
|       | 外用液剤                | 全身性の副作用軽減                 | インテバン®外用液など              |

# NSAIDs

## ➤ アントラニル酢酸系

□ ポンタールカプセル250mg、シロップ32.5mg/ml（メフェナム酸）

- ・比較的強い鎮痛作用を有する
- ・シロップ剤は適度の甘味とレモン味で飲みやすい(D-ソルビトール0.21g/ml、白糖0.1g/ml含有)

## ➤ アリール酢酸系(フェニル酢酸系)

□ ボルタレン錠25mg、SRカプセル37.5mg、坐剤25、50mg（ジクロフェナクナトリウム）

- ・他のNSAIDsと比べて強力な消炎、鎮痛、解熱作用を期待できる
- ・胃部不快感や消化管出血の頻度が比較的高い

## ➤ アリール酢酸系(インドール酢酸系)

□ インテバンSPカプセル25mg、坐剤25、50mg(インドメタシン)

- ・インドメタシンは作用が強いが、COX1阻害作用が強く胃腸障害が多いといわれている
- ・インテバンSPは吸収の個体差が少なく、安定した薬効が期待できる
- ・ボルタレン坐剤に比べるとインテバン坐剤は作用時間が長い。直腸刺激作用が少なく、室温でも安定

□ クリナリル錠100mg(スリンダク)

- ・強力な消炎、鎮痛、解熱作用である
- ・プロドラッグのため胃腸障害が少なく、重症の肝障害では効果が減弱するといわれている
- ・腎組織において再度非活性型に変換されるため、腎機能障害が少ないとされている
- ・腸肝循環を有するため、小腸潰瘍に注意が必要である

# NSAIDs

## ➤ **アリール酢酸系 (ピラノ酢酸系)**

### □ ハイペン錠200mg(エトドラク)

- ・消炎、鎮痛、解熱作用のバランスが良い
- ・COX2選択性が高い
- ・がん疼痛に十分な効果を得るために投与量の調節が必要(海外での常用量は日本の1.5~2倍以上)
- ・胃腸障害や腎機能障害は一般的なNSAIDsより少ない。継続投与の場合には、定期的な注意が必要

## ➤ **プロピオン酸系**

### □ ソレトン錠80mg(ザルトプロフェン)

- ・消化管障害が少ないといわれている

### □ ロキソニン錠60mg(ロキソプロフェン)

- ・プロドラックのため胃腸障害が少なく、重症の肝障害では効果が減弱するといわれている
- ・血中濃度の立ち上がり早いとされている

### □ ブルフェン錠100mg(イブプロフェン)

- ・スイッチOTC薬
- ・常用量では鎮痛作用のみで、抗炎症作用は弱い

### □ ロピオン注50mg(フルルビプロフェンアキセチル)

- ・プロドラックでリポ化製剤
- ・鎮痛効果の発現は平均20分と速やかである



# NSAIDs

## ➤ オキシカム系

### □ モービック錠10mg(メロキシカム)

- ・消炎、鎮痛、解熱作用の強力である
- ・半減期が28時間と長いため、高齢者や腎・肝機能障害患者の投与には注意が必要
- ・胃腸障害や腎機能障害は一般的なNSAIDsより少ない。継続投与の場合には、定期的な注意が必要

### □ ロルカム錠4mg(ロルノキシカム)

- ・他のオキシカム系と比べて血中濃度の速やかな立ち上がり、代謝が早いため蓄積性が少ない  
(Tmax:0.5時間、T1/2:2.5時間)

## ➤ コキシブ系

### □ セレコックス錠100mg(セレコキシブ)

- ・COX2選択的阻害薬。外国においてCOX2選択的阻害薬の投与により、心血管系血栓塞栓性事象のリスク増大させる可能性があるといわれている
- ・空腹時:吸収30%低下

## ➤ 塩基性

### □ ソランタール錠100mg(チアラミド)

- ・塩基性消炎鎮痛剤
- ・プロスタグランジン系には作用しないため、作用は弱い副作用も少ない

# アセトアミノフェン

## ✓アセトアミノフェン

### ピリナジン散、コカール錠(200mg)

- 国内でも国際的な標準用量が投与可能となった  
1回300～1,000mg、投与間隔:4～6時間以上、1日総量として4,000mgまで
- アラキドン酸からプロスタグランジンを産生する経路の律速酵素であるCOXを阻害することにより解熱鎮痛作用を生じる(抗炎症作用はない)
- 投与後、ほぼ完全に吸収され血漿濃度は30～60分でピークに達する
- 治療上有効な血中濃度:5～20 μg/ml
- 過剰量となり活性代謝産物(NAPQI)の解毒にかかわるグルタチオン抱合能力が限界に達すると、NAPQIが蓄積し、肝細胞構成蛋白と共有結合して肝細胞障害が惹起される (NAPQI:N-アセチル-p-ベンゾキノンイミン)
- 服用後の血中濃度4時間値:200 μg/ml、12時間値:50 μg/mlを越すと約60%に高度の肝障害を生じる