

## 薬剤部 DI ニュース

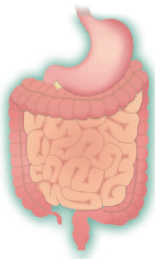
—国内初の末梢性 $\mu$ オピオイド受容体拮抗薬—

## スインプロイク錠

オピオイド鎮痛薬の副作用として便秘が多く見られますが、平成29年6月にオピオイド誘発性便秘症治療薬「スインプロイク錠 0.2mg」が販売開始されました。そこで今回は、スインプロイク錠についてまとめてみました。

## ●オピオイド誘発性便秘症はなぜ起こるのか？

オピオイド鎮痛薬は、大脳皮質、視床、中脳、延髄、脊髄などに存在するオピオイド受容体に結合して、鎮痛作用を示します。オピオイド鎮痛薬はオピオイド受容体（主に $\mu$ 受容体）に結合し、上行性痛覚伝導路の抑制、下行性痛覚抑制系の亢進により鎮痛作用をもたらします。オピオイド鎮痛薬は消化管に存在する $\mu$ 受容体にも結合して消化酵素の分泌、消化管の蠕動運動を抑制するため、便秘が起こります。



## ●消化酵素の分泌・消化管の蠕動運動抑制

- 食物消化の遅滞・消化管での食物通過時間延長
- 水分吸収が亢進
- 便が固くなる

## ●肛門括約筋の緊張

- 排便しにくくなる

➡ 便秘が発現

## \*上行性痛覚伝導路

末梢から中枢に至る経路。痛み刺激が伝達されて痛みとして感知される。

## \*下行性痛覚抑制系

脳から脊髄に至る経路。痛みを抑制する働きを持つ。

## ●スインプロイクとはどのような製剤？

## ✓ 剤形



直径：約 6.5 mm

厚さ：約 3.5 mm

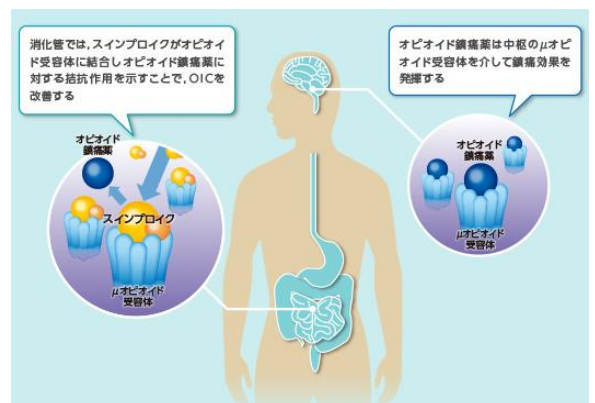


実物大



## ✓ オピオイド誘発性便秘症に効果を発揮する

スインプロイクは、オピオイド鎮痛薬による消化管運動・消化管神経活動の抑制作用に対して拮抗することで、便秘を改善します。さらにスインプロイクには、中枢への移行性を低くする構造があり、オピオイド鎮痛薬の主作用を阻害しにくくなっています。



## ✓ 1回 0.2mg を 1日 1回経口投与

\* OIC：オピオイド誘発性便秘症 (opioid-induced constipation)

✓ **副作用**に注意！

オピオイド誘発性便秘症を有するがん患者を対象とした国内臨床試験において、**下痢**の副作用が認められています。さらに、スインプロイク発売後3ヶ月における調査でも下痢の発現が報告されているため、観察を十分に行う必要があります。また、発症のおそれがあるため次の症状にも注意する必要があります。

- **オピオイド離脱症候群**  
一般的には、投与数分あるいは数日以内に**不安、悪心、嘔吐、筋肉痛、流涙、鼻漏、散瞳、発汗**などの症状が発現するおそれがあります。
- **オピオイド鎮痛薬の作用減弱**
- **消化管穿孔**
- **心血管系事象**

✓ 次の患者には**投与禁忌**！

- スインプロイクの成分（ナルデメジントシル酸塩）に過敏症の既往歴のある患者
- **消化管閉塞**若しくはその疑いのある患者、又は消化管閉塞の既往歴を有し再発のおそれの高い患者  
→腸管蠕動運動の促進により腸管の閉塞による症状が憎悪し、**消化管穿孔**に至るおそれがあります。

\*ちなみに、次のようなオピオイド鎮痛薬が採用されています。

一般名	商品名
モルヒネ硫酸塩	カディアンカプセル 20 mg
モルヒネ塩酸塩	オプソ内服液 5mg, 10mg
	アンペック坐剤 10mg, 20mg
	アンペック注 10mg/1mL/A, 50mg/5mL/A, 200mg/5mL/A
オキシコドン塩酸塩	オキシコンチン錠 5mg, 10mg, 40mg
フェンタニル	フェントステープ 1mg, 4mg
	イーフェンバック錠 50 μg
	アブストラル舌下錠 100 μg, 200 μg
	フェンタニル注 0.1mg/2mL/A
コデインリン酸塩	コデインリン酸塩酸 1%
	コデインリン酸塩錠 20mg
ブプレノルフィン塩酸塩	レペタン坐剤 0.2mg, 0.4mg
	レペタン注 0.3mg/1.5mL/A
ペンタゾシン	ソセゴン注射液 15mg/1mL/A
	ペンタジン注射液 15mg/1mL/A

参考：がん疼痛の薬物療法に関するガイドライン（2014年版）

[https://www.shionogi.co.jp/med/products/drug\\_sa/qdv9fu0000015cmq.html](https://www.shionogi.co.jp/med/products/drug_sa/qdv9fu0000015cmq.html)（塩野義製薬 HP）

薬がみえる vol.1