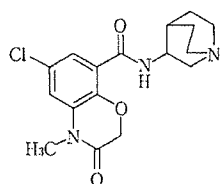


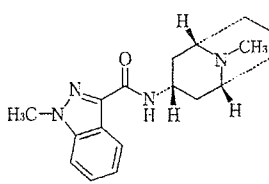
「-setron」:5-HT₃選択的セロトニン受容体拮抗薬

現在、11種のセロトニン受容体が知られているが、「-setron」は、5-HT₃選択的なセロトニン受容体拮抗薬を示すステムである。5-HT₃受容体は、消化管粘膜の求心性迷走神経終末や嘔吐中枢にある。5-HT₃受容体選択的拮抗薬は、主に制吐薬として使用される。図9にステム「-setron」を持つ主な医薬品を示す。

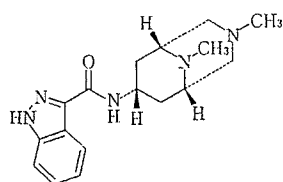
Azasetron(アザセトロン), Granisetron(グラニセトロン), Indisetron(インジセトロン), Ondansetron(オンダンセトロン), Ramosetron(ラモセトロン), Tropisetron(トロピセトロン)のそれぞれ塩酸塩は、制吐薬として使われている。Itasetron(イタセトロン), Fabesetron(ファベセトロン)は、JAN品目であるが未承認である。Dolasetronは、USPに記載されているが日本では未承認である。Palonosetronも、日本では未承認である。



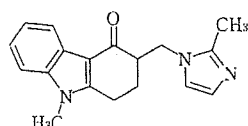
Azasetron(アザセトロン)



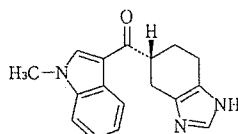
Granisetron(グラニセトロン)



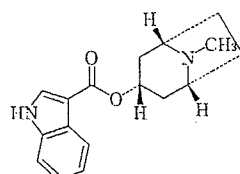
Indisetron(インジセトロン)



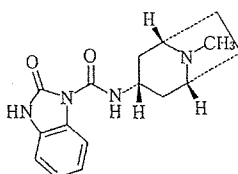
Ondansetron(オンダンセトロン)



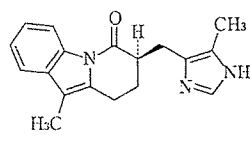
Ramosetron(ラモセトロン)



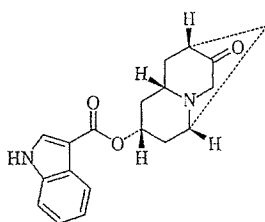
Tropisetron(トロピセトロン)



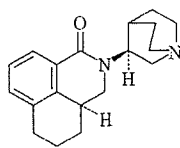
Itasetron
(イタセトロン,未承認)



Fabesetron
(ファベセトロン,未承認)



Dolasetron(日本未承認)



Palonosetron(日本未承認)

図9 5-HT₃選択的セロトニン受容体拮抗薬を示すステム「-setron」を持つ医薬品

Ketanserinは、5-HT_{2A}受容体拮抗作用を示すことが報告されている。

「-erg-」:麦角アルカロイド誘導體

「-erg-」は、麦角アルカロイド誘導體を示すステムである。麦角アルカロイド(ergot alkaloid)は、ライ麦や小麦に寄生する麦角菌(*Claviceps purpurea*など)が作るマイコキシンでリゼルグ酸骨格(図10)を持つ。麦角アルカロイド誘導體を示すステム「-erg-」を持つ医薬品を図10に示す。

Ergotamine(エルゴタミン), Dihydroergotamine(ジヒドロエルゴタミン)は、脳血管のセロトニン受容体作動薬であり、脳実質への血流量が増大することにより抗片頭痛作用を示す。Ergometrine(エルゴメトリン), Methylergometrine(メチルエルゴメトリン)は、子宮の平滑筋を収縮させ、子宮収縮止血薬として用いられる。また、Dihydroergotoxine(ジヒドロエルゴトキシン), Nicergoline(ニセルゴリン)は、脳代謝・末梢循環改善薬として用いられている。選択的ドパミン作動性のあるTerguride(テルグリド)は、排卵誘発剤として使われる。Pergolide(ベルゴリド)のメシル酸塩、およびCabergoline(カベルゴリン)は、ドパミンD₂(およびD₁)受容体に作動し、パーキンソン病治療に用いられている。日局には、エルゴタミンおよびエルゴメトリンの酒石酸

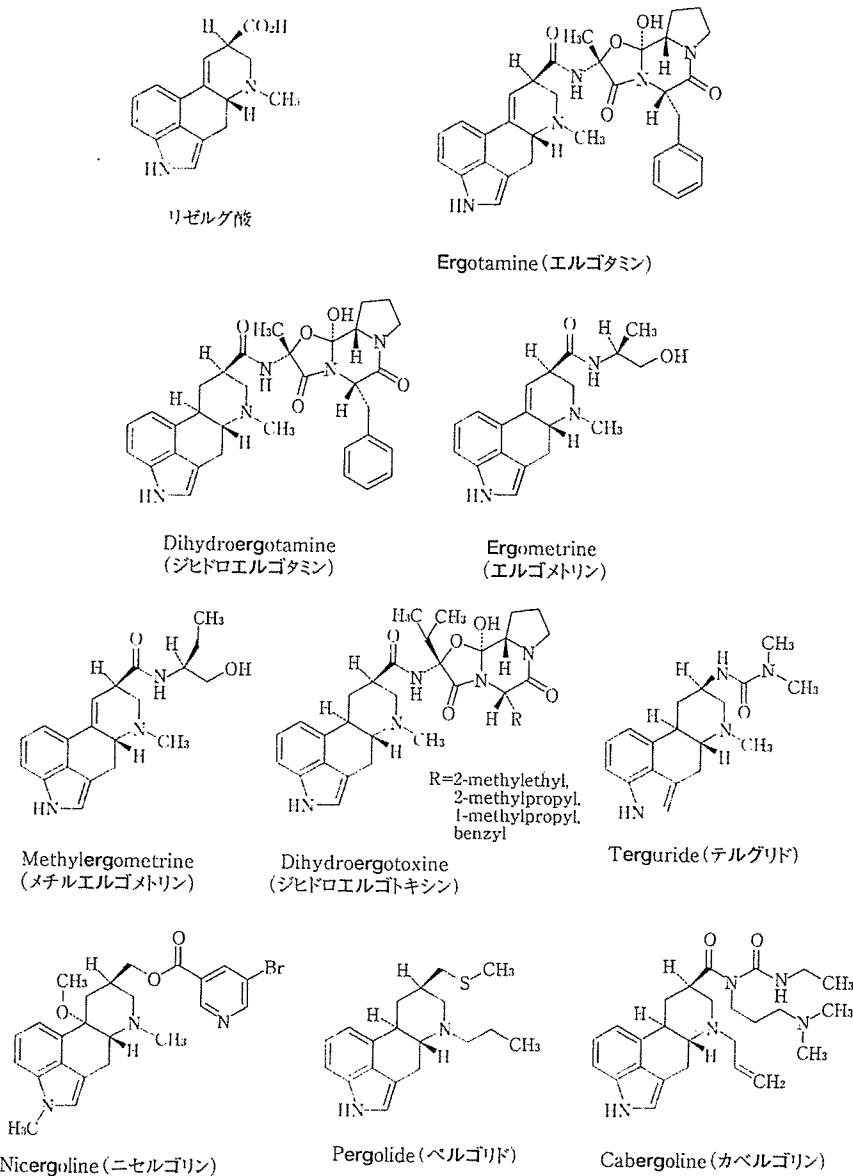


図10 リゼルグ酸の構造, および, 麦角アルカロイド誘導体を示すステム「-erg-」を持つ医薬品

塩, ジヒドロエルゴタミンおよびジヒドロエルゴトキシンのメシル酸塩, メチルエルゴメトリンのマレイン酸塩が収載されている。

以上, 今回は, 中枢神経系に作用する薬を示すステムを中心に, 「-oxetine」, 「-giline」, 「-moxin」, 「-pin(e)」, 「-pramine」, 「-triptyline」, 「-anserin」, 「-setron」, 「-erg-」を紹介した。

■参考資料

最近, 本協作成に参考しているWHOのINNのステムに関する文献「The use of stems in the selection of International Nonproprietary Names (INN) for pharmaceutical substances」の最新版(WHO/PSM/QSM/2006.3)が公開された。以下のURLからpdfファイルでダウンロード可能である。
<http://www.who.int/medicines/services/inn/FinalStemBook2006.pdf>