

医療トピックス

トリプタン製剤について

鹿児島市医師会病院薬剤部 | 瀧下 恭子

セロトニン受容体作動薬であるトリプタン製剤は、急性期の片頭痛治療薬として有効性の高い薬剤です。トリプタン製剤はセロトニン (5-HT)₁ 受容体, 特に 5-HT_{1B}, 5-HT_{1D} 受容体に選択的に作用して、頭痛発作時に過度に拡張した頭蓋内外の血管を収縮させることにより片頭痛を改善します。また、三叉神経に作用して神経終末からの炎症を惹起するカルシトニン遺伝子関連ペプチドの放出を抑制することも、片頭痛の緩解に寄与していると考えられています。

トリプタン製剤は、頭痛発作が起きたらすぐに服用することで効果を最も発揮します。繰り返す頭痛発作を恐れ予兆期の段階で服薬すると、服薬のタイミングが早すぎて効果が落ちてしまいます。一方、頭痛発作後1時間ぐらい経過してから服用しても効果が落ちてしまうため、服薬のタイミングが重要です。

トリプタン製剤が使用されるようになり20年以上が経過しましたが、重篤な副作用の報告は少なく、安全性が高い薬剤と言われています。副作用として比較的多いのは、頸部、

胸部、喉、肩の締め付け感や圧迫感、息苦しさといった不快感で、トリプタン製剤特有の副作用です。これらは、一過性で重篤ではなく、心筋虚血との関連は薄く、食道平滑筋の運動亢進や肺動脈に対する影響、骨格筋のエネルギー代謝の異常、痛感受性の増加などが原因と考えられています。

トリプタン製剤は反応性の個人差が大きいと考えられ、1つのトリプタン製剤が無効であったり、効果が不十分な場合でも他のトリプタン製剤では有効な場合があります。実臨床においては薬剤の切り替えを行うこともあります。2022年11月時点で処方可能なトリプタン製剤は5種類あります。各トリプタン製剤の使い分けに関しては明らかなエビデンスはありませんが、効果発現時間や効果持続時間、服薬間隔等は各薬剤で異なります。以下、トリプタン製剤についてまとめました。

参考文献

各社インタビューフォーム
薬局2021 Vol.72 No.8 (南山堂)
月刊薬事2021 Vol.63 No.11 (じほう)

商品名	イミグラン			ゾーミッグ®		レルバックス®	マクスルト®		アマージ
一般名	スマトリプタン			ゾルミトリプタン		エレトリプタン	リザトリプタン		ナラトリプタン
発売年	2001年(錠剤) 2003年(点鼻液) 2008年(キット皮下注)			2001年(錠剤) 2002年(RM錠)		2002年	2003年		2008年
剤型	錠剤	点鼻液	キット皮下注	錠剤	RM錠	錠剤	錠剤	RPD錠	錠剤
規格	50mg	20mg/1容器	3mg/1シリンジ	2.5mg	2.5mg	20mg	10mg	10mg	2.5mg
1回投与量 (最大投与量)	50mg (100mg)	20mg	3mg	2.5mg (5mg)	2.5mg (5mg)	20mg (40mg)	10mg	10mg	2.5mg
追加投与間隔	2時間	2時間	1時間	2時間	2時間	2時間	2時間	2時間	4時間
1日最大投与量	200mg	40mg	6mg	10mg	10mg	40mg	20mg	20mg	5mg
最高血中濃度 到達時間 (時間)	1.8	1.3	0.18	3 (未変化体)	2.98 (未変化体)	1.0	1.0	1.3	2.68
消失半減期 (時間)	2.2	1.87	1.71	2.4 (未変化体)	2.9 (未変化体)	3.2	1.6	1.7	5.05
代謝	MAO-A			未変化体: CYP1A2 活性代謝物: MAO-A		CYP3A4	MAO-A		CYP1A2, CYP2C9, CYP2D6 CYP2E1, CYP3A4/5 など
併用禁忌薬	エルゴタミン エルゴタミン誘導体含有製剤 5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬 MAO阻害剤投与中あるいは 投与中止2週間以内			エルゴタミン エルゴタミン誘導体含有製剤 5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬 MAO阻害剤投与中あるいは 投与中止2週間以内		エルゴタミン エルゴタミン誘導 体含有製剤 5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬 HIVプロテアーゼ 阻害剤	エルゴタミン エルゴタミン誘導体含有製剤 5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬 MAO阻害剤投与中あるいは 投与中止2週間以内 プロプラノロール投与中あるいは 投与中止から錠剤24時間、徐放 製剤48時間以内		エルゴタミン エルゴタミン誘導 体含有製剤 5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬

RM: 口腔内速溶 RPD: 口腔内崩壊 CYP: シトクロムP450 5-HT: セロトニン MAO: モノアミン酸化酵素 HIV: ヒト免疫不全ウイルス