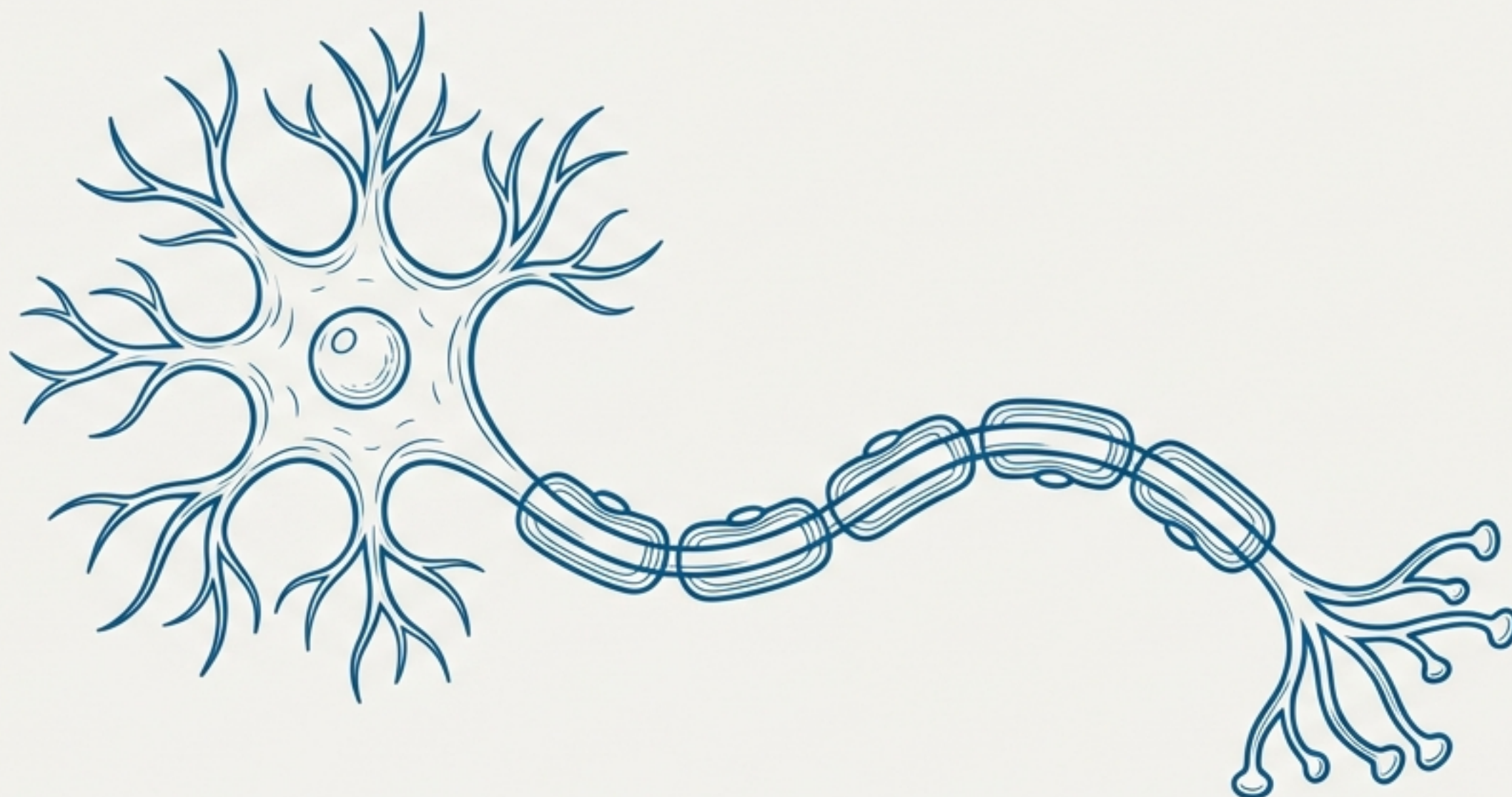




薬剤師国家試験から学ぶ、局所麻酔薬の核心原理

94回 問124 徹底解説



この一問が試す、薬剤師としての基礎知識

第94回薬剤師国家試験問題 問124

局所麻酔薬に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 感覚の消失は、運動機能、触覚、痛覚の順に起こる。
- 2 リドカインの作用を持続させる目的で、アドレナリンが併用される。
- 3 プロカインは、表面麻酔に用いられる。
- 4 オキセサゼインは、胃酸分泌を亢進させる。
- 5 ジブカインは、偽性コリンエステラーゼによって速やかに分解される。

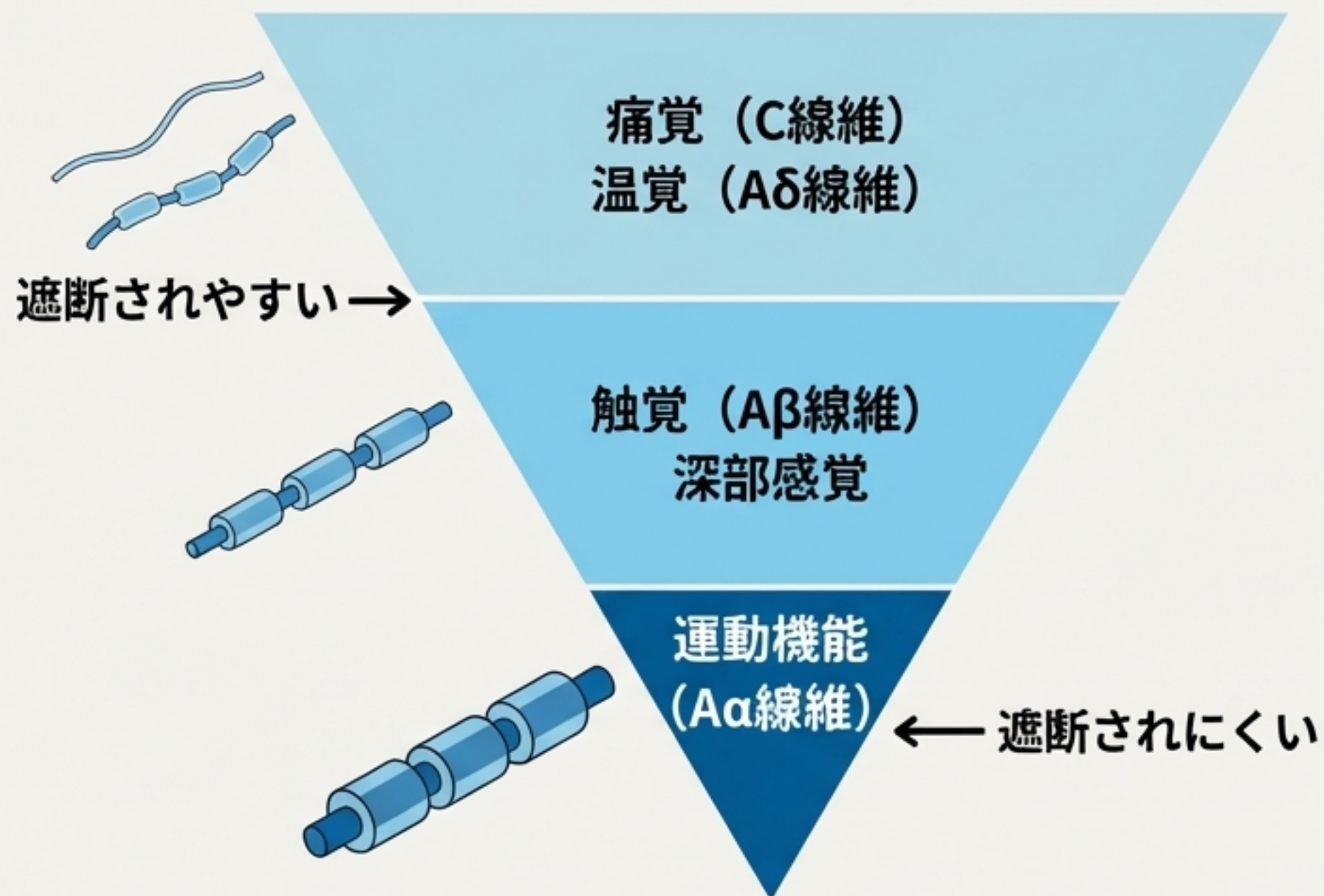
「局所麻酔薬に関するこの問題は、単なる暗記では太刀打ちできません。」

「作用機序、薬物動態、臨床応用。複数の重要概念が凝縮されています。」

「この一問を完璧に理解することは、局所麻酔薬の分野をマスターすることに繋がります。各選択肢を徹底的に解剖していきましょう。」

なぜ感覚は「痛み」から消えるのか？

神経線維の感受性

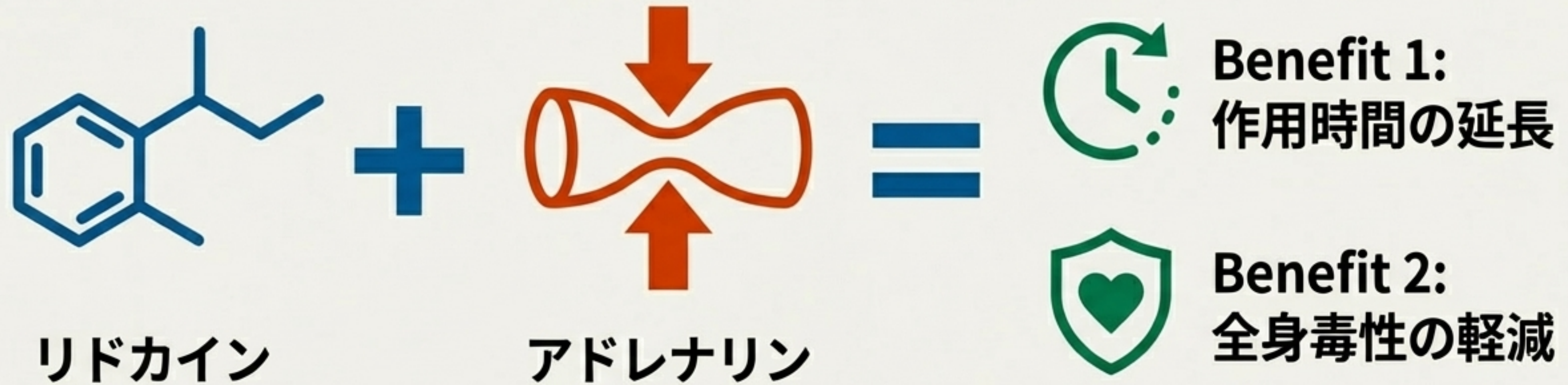


「局所麻酔薬は、神経線維の種類によって遮断の受けやすさが異なります。」

原則：細く、髄鞘を持たない線維ほど、低濃度で速く遮断されます。

記憶のヒント：
『生命維持に必須の機能が最後まで残る』

リドカイン+アドレナリン：1+1が2以上になる協力体制



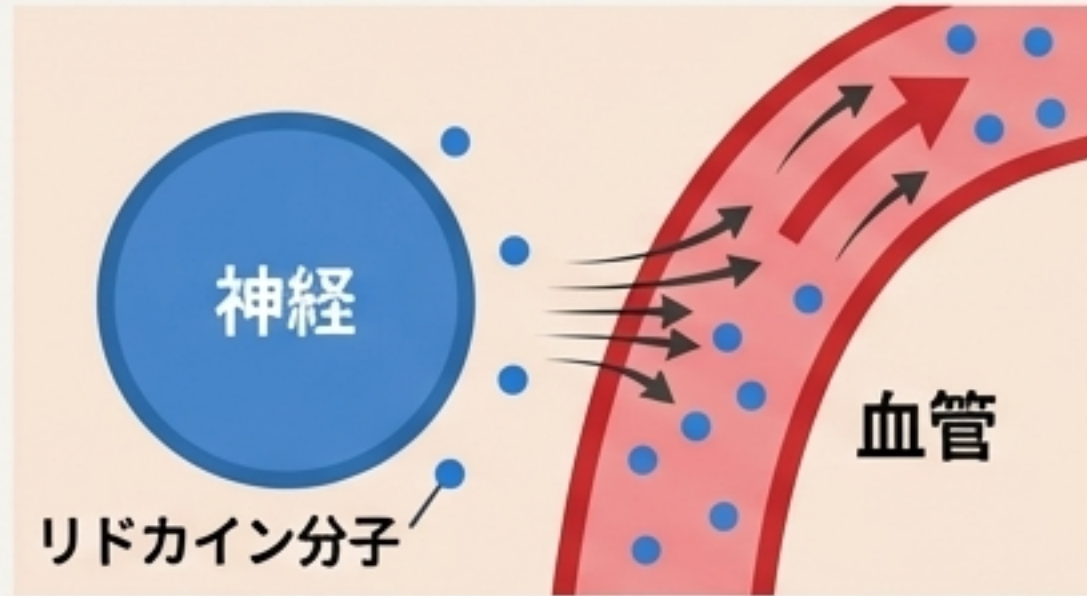
「リドカインにアドレナリンを併用する目的は、主に2つの薬理効果を最大化するためです。」

「この2つの効果は、アドレナリンの強力な『血管収縮作用』という一つのメカニズムから生まれます。」

効果のメカニズム①：作用部位に薬剤を閉じ込める

作用時間の延長

リドカイン単独



血流により速やかに吸収される

リドカイン+アドレナリン併用

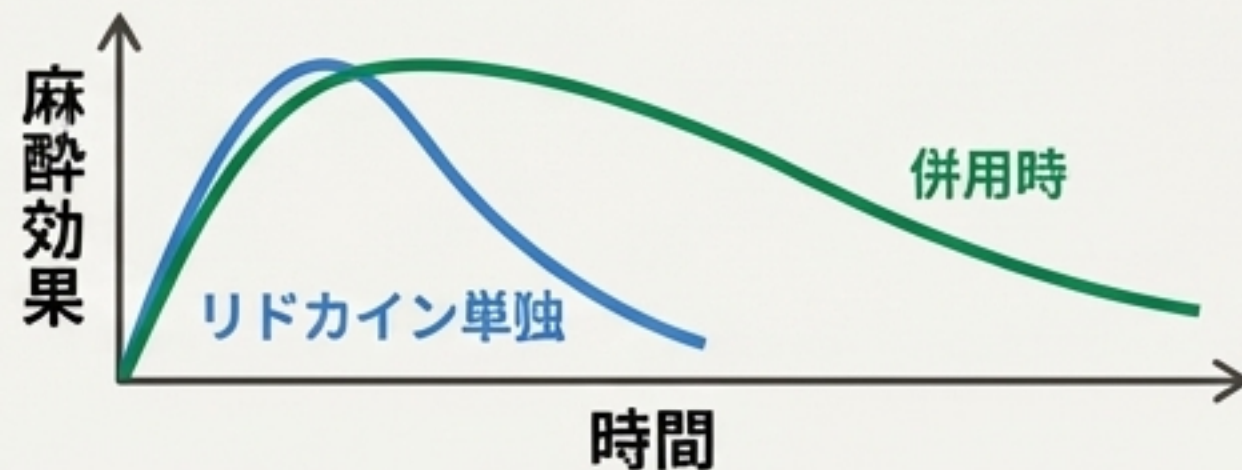


血管収縮により吸収が遅延

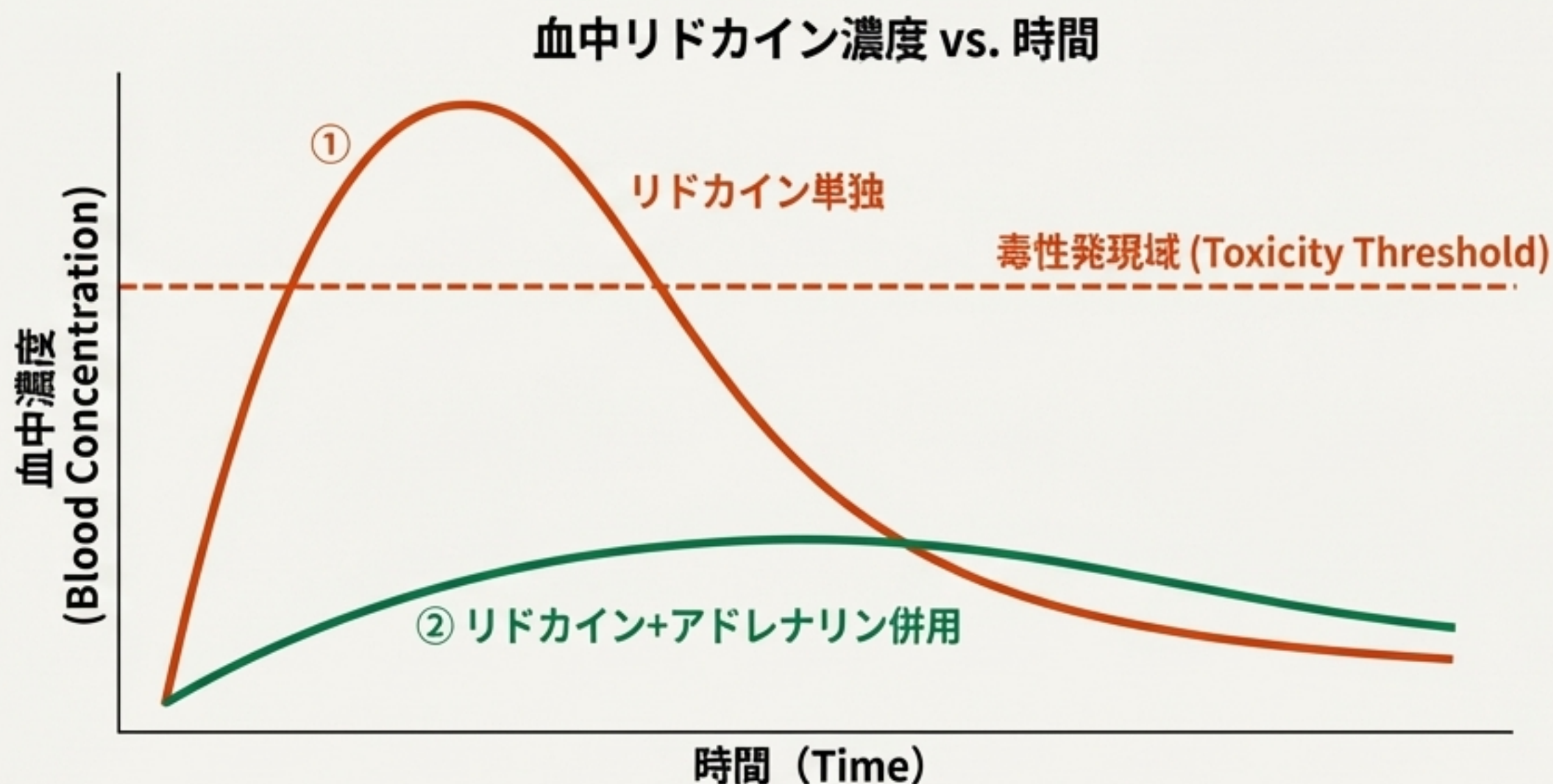
「アドレナリンが注射部位の血管を強力に収縮させます。」

「血流への吸収速度が著しく遅くなることで、リドカインが神経周囲に高濃度で留まります。」

麻酔効果の持続時間



効果のメカニズム②：血中濃度の上昇を抑制し、安全性を高める 全身毒性の軽減



「吸収速度が遅くなることで、リドカインの最高血中濃度 (Cmax)の上昇を防ぎます。」

「これにより、中枢神経毒性や心毒性の発現リスクが大幅に軽減されます。」



【重要：禁忌】
血流が乏しい末梢部位（指、鼻、陰茎など）には虚血のリスクがあるため、アドレナリン併用は絶対禁忌です。

なぜプロカインは表面麻酔に使えないのか？ 脂溶性という「鍵」

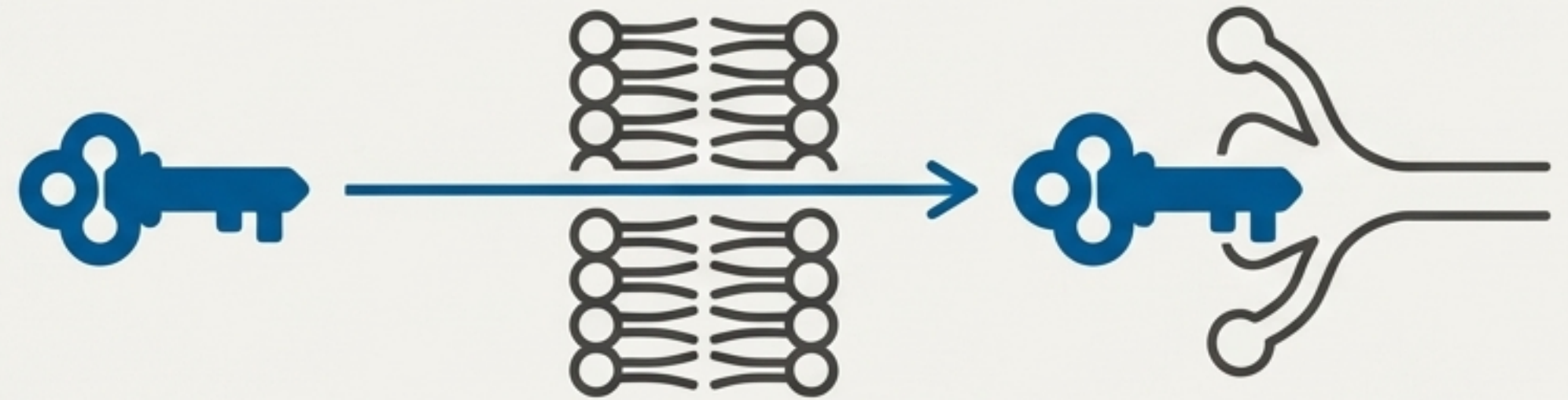
Principle

「表面麻酔薬は、皮膚や粘膜を透過し、下層の神経に到達する必要があります。」

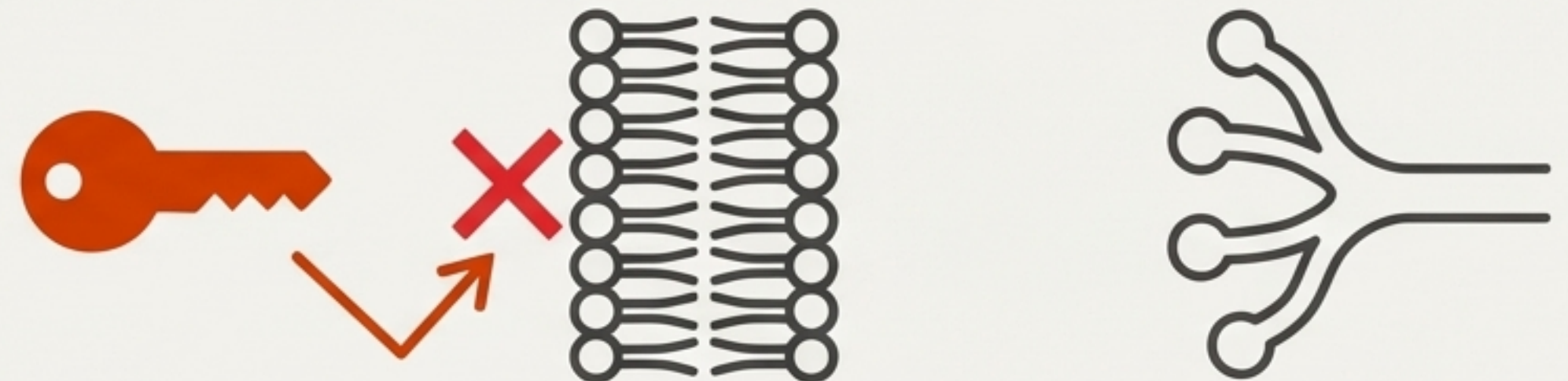
Reasoning

- そのためには、細胞膜（脂質二重層）を通過できる高い脂溶性が求められます。
- プロカインはエステル型ですが、脂溶性が低いため組織透過性が不十分です。

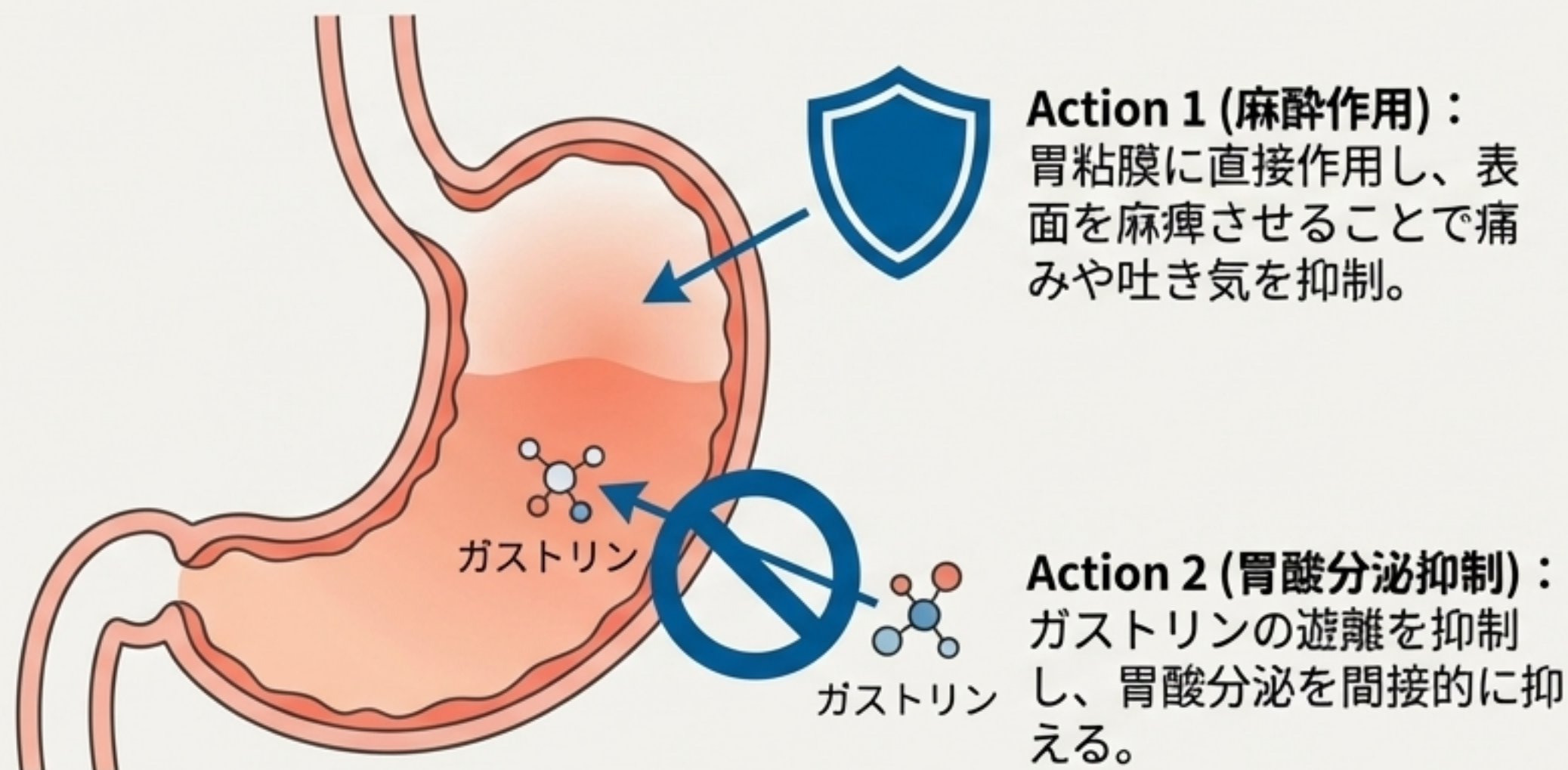
高脂溶性薬剤（例：リドカイン）



低脂溶性薬剤（プロカイン）



オキセサゼイン：強酸性の胃で働く特殊な局所麻酔薬



Unique Feature 特徴

「胃酸という強力な酸性条件下でも有効性を失わない特殊な構造を持つ。」

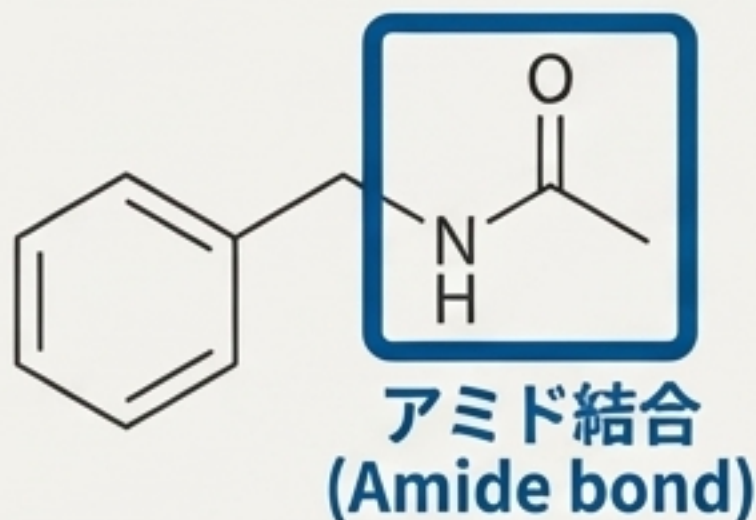
臨床用途

胃炎、食道炎、胃・十二指腸潰瘍に伴う急性症状

アミド型 vs エステル型：構造の違いが運命を決める

「局所麻酔薬は、分子内の化学結合によって『アミド型』と『エステル型』の2つに大別されます。この違いが作用時間と代謝経路を決定づけます。」

アミド型 (Amide-type)

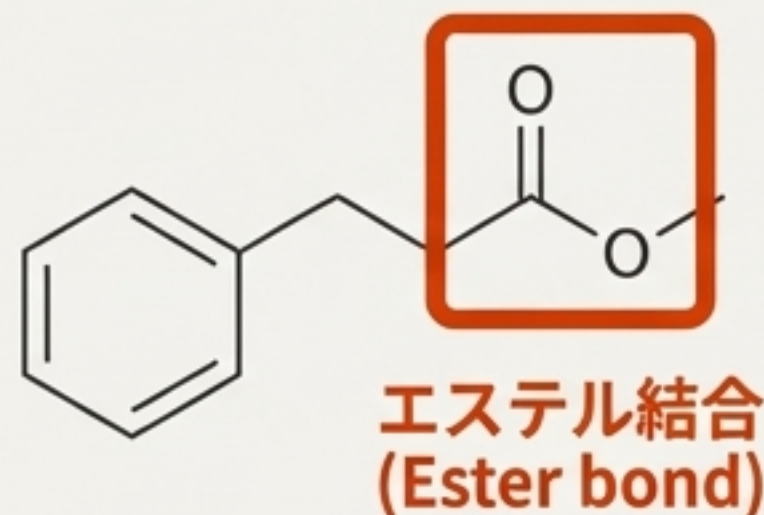


リドカイン (Lidocaine), **ジブカイン (Dibucaine)**,
メピバカイン (Mepivacaine)



安定 (Stable)

エステル型 (Ester-type)



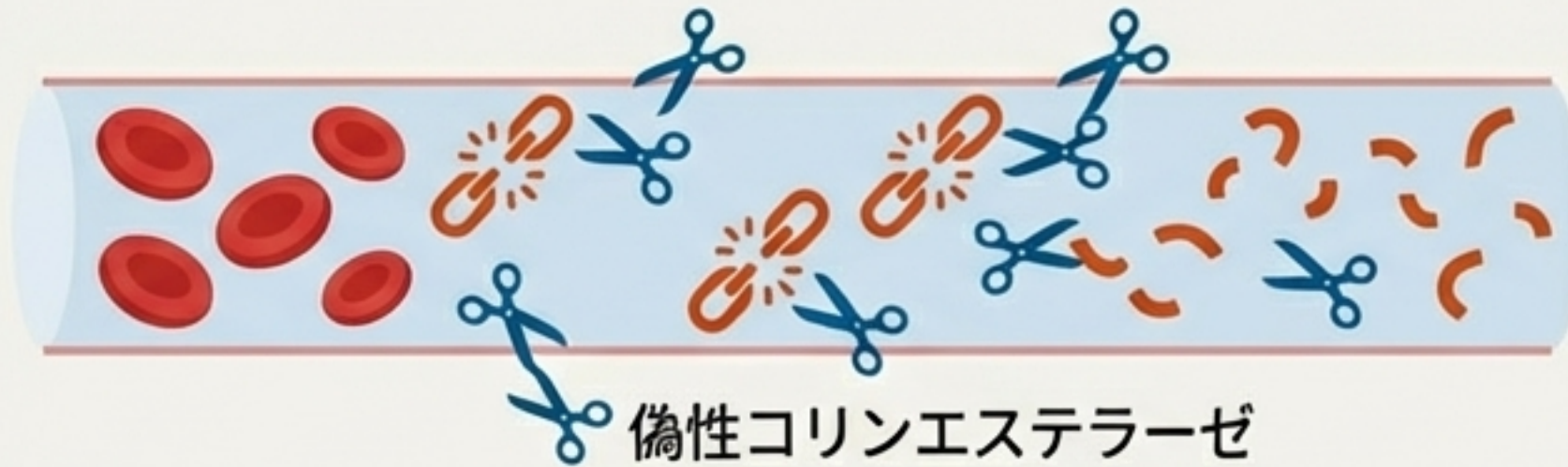
コカイン (Cocaine), **プロカイン (Procaine)**,
テトラカイン (Tetracaine)



不安定 (Unstable)

代謝の物語：血漿中での分解速度の違い

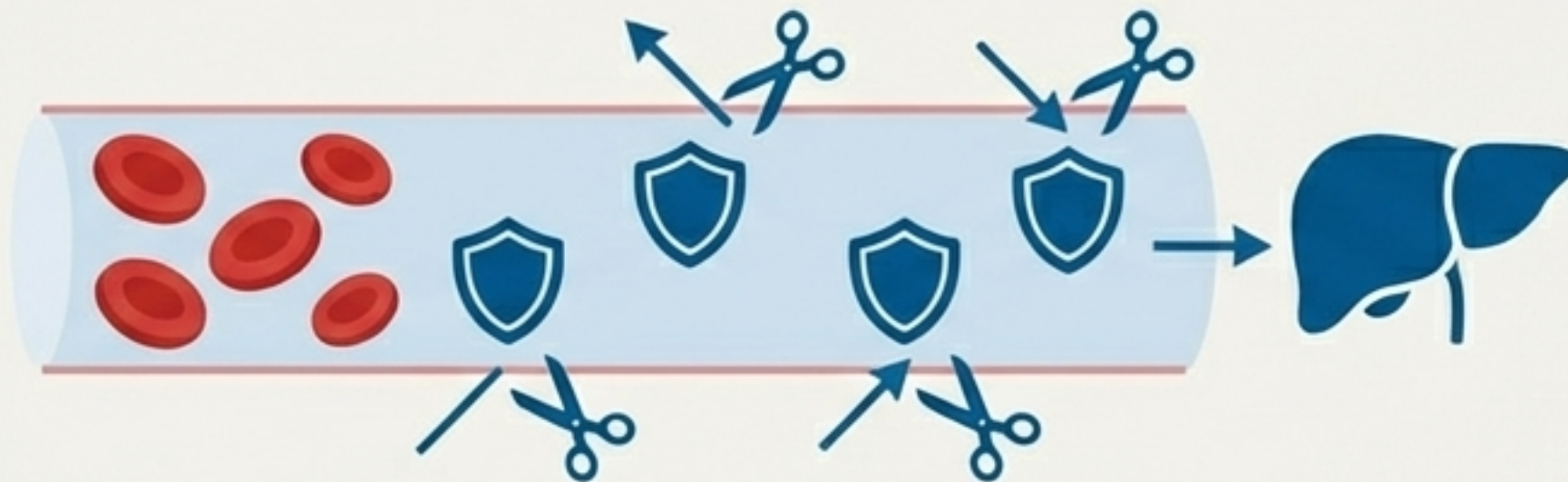
エステル型の運命 (Fate of Ester-types)



「エステル型は、血漿中に豊富に存在する**偽性コリンエステラーゼ**によって速やかに加水分解される。」

結果：作用時間が短い。

アミド型の運命 (Fate of Amide-types)



「アミド型は、この酵素で分解されにくく安定。主に肝臓で代謝される。」

結果：作用時間が長い。（例：ジブカイン）

Technical Note: 「偽性コリンエステラーゼはアセチルコリン以外のエステル結合を分解。神経終末の真正コリンエステラーゼ（アセチルコリン専門）とは異なる。」

知識の統合：問124の選択肢を完全攻略する

薬剤	分類	核心となる特徴	臨床的意義	設問との関連
リドカイン	アミド型	アドレナリンとの併用効果	作用延長・毒性軽減	✓ 正 作用持続のために併用される
プロカイン	エステル型	低脂溶性	表面麻酔に不適	✗ 誤 組織透過性が低く表面麻酔には使えない
オキセサゼイン	特殊	耐酸性・ガストリン抑制	胃炎・潰瘍治療	✗ 誤 胃酸分泌を抑制する
ジブカイン	アミド型	偽性ChEに非分解	長時間作用	✗ 誤 アミド型のため分解されにくい
感覚消失の順序	原理	痛覚/温覚 → 触覚 → 運動	細い・無髄線維から遮断	✗ 誤 設問の順序は逆

局所麻酔薬マスターのための「不変の法則」



遮断順序の法則

細い・無髄線維から
太い・有髄線維へ



透過性の法則

表面麻酔の効力は脂溶性に依存



アドレナリンの法則

血管収縮 → 作用延長 + 毒性軽減



構造と代謝の法則

エステル型は血漿で速やかに分解、
アミド型は肝臓で緩やかに分解