

# Anticoagulant, thrombolytic and antiplatelet drugs

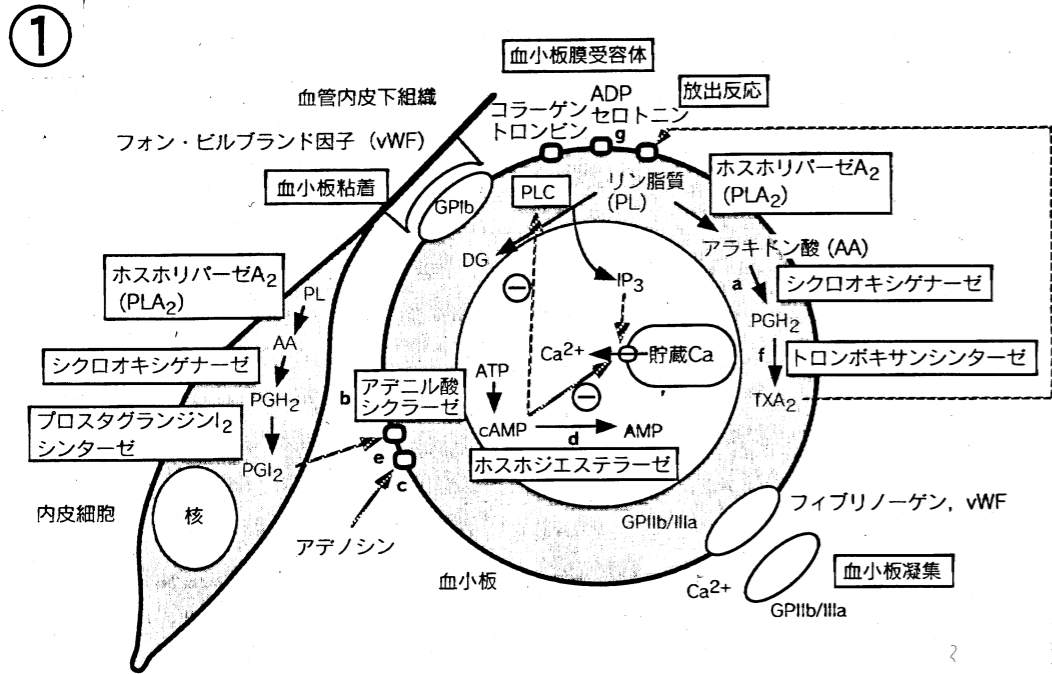
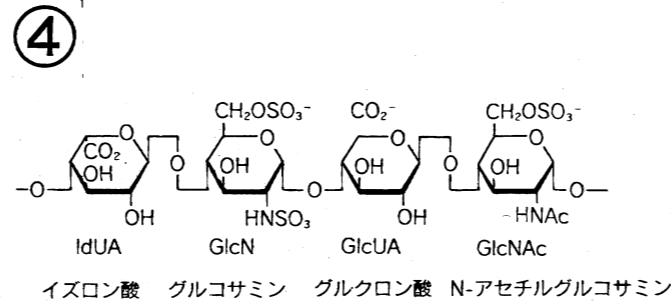
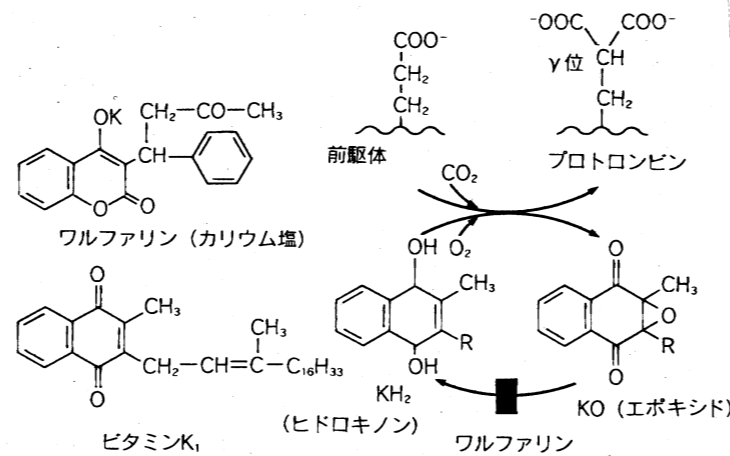


図 8-5 血小板の機能と抗血小板薬の作用機序



A. ヘパリンの化学構造 (一部). 陰性に荷電している.



B. ワルファリンとビタミンK<sub>1</sub> C. プロトロンビン前駆体のγ-カルボキシル化とワルファリンの作用機序

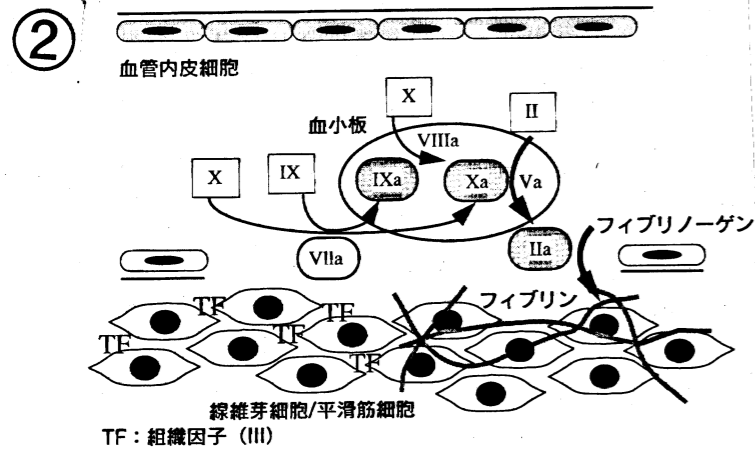
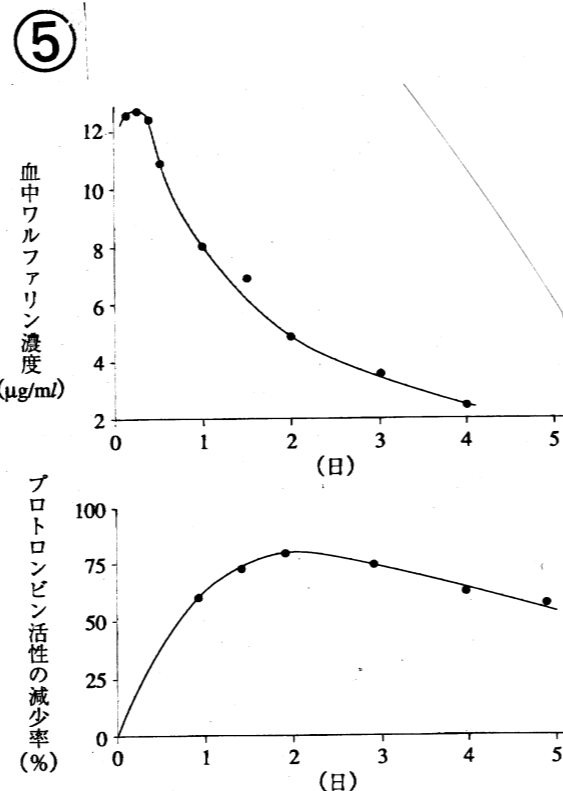


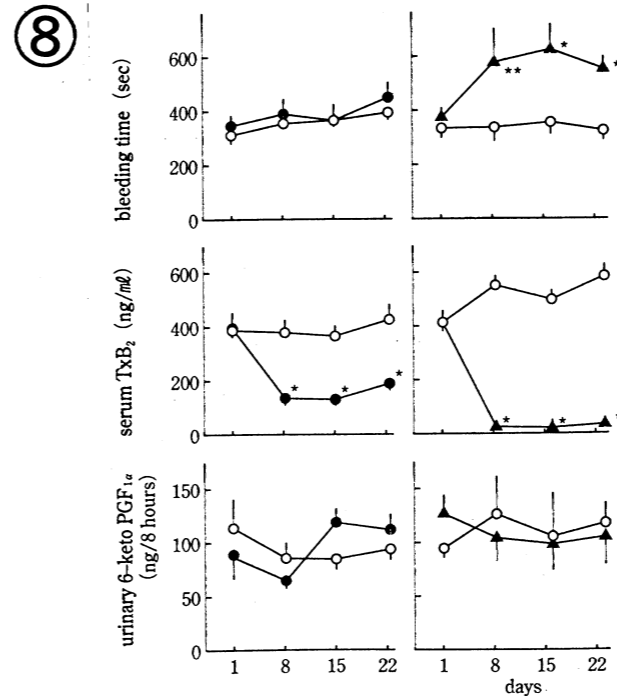
図 8-6 血栓形成の場と主要反応 文献より改変

表 8-1 血栓症 thrombosis と出血 hemorrhage 性疾患の治療薬概観

疾患, 病態, 病因	治療薬
動脈血栓症: 心筋梗塞, 脳梗塞 動脈壁の異常: 糖尿病, 動脈硬化性疾患 血小板の関与 (白色血栓); 血小板血症 汎発性血管内血液凝固症候群 (DIC)	血栓溶解薬, 抗凝固薬 抗血小板薬 ヘパリン, AT III, 合成抗トロンピン 抗凝固薬
静脈血栓症: 深部静脈血栓症に合併する肺塞栓 (梗塞) 血流の障害, 凝固性亢進	止血薬 血管強化薬 血小板輸血, 副腎皮質ステロイド ビタミン K, 凝固因子 抗プラスミン薬
出血性疾患 1) 血管壁の異常脆弱性, 透過性亢進 2) 血小板減少, 機能低下 (血小板減少性紫斑病) 3) 凝固因子系の障害 (血友病) 4) 線溶系の亢進	



ワルファリン単回投与時の血中濃度とプロトロンビン活性減少率の経時変化



○—○ プラセボ, ●—● ASA 10mg/d, ▲—▲ ASA 30mg/d, \* p<0.01, \*\* p<0.05

図 4 アスピリン少量投与における TXA<sub>2</sub>並びに PGI<sub>2</sub>抑制効果

表 3 現在臨床応用されている抗血小板薬の作用機序

薬剤名	主たる薬理作用	血小板反応に対する作用		内皮下増殖抑制	血管拡張作用	本邦での適応症
		粘着抑制	凝集抑制			
アスピリン (スルフィンピラゾン)	シクロオキシゲナーゼ阻害	×	△	×	×	抗炎症・鎮痛
ジピリダモール	フォスホジエステラーゼ阻害	△	△	×	○	狭心症・ 心筋梗塞, うっ血性心不全
チクロピジン	フィブリノゲンの血小板膜への結合阻害+α	○	○	?	×	血栓症 血流障害改善
シロスタゾール	フォスホジエステラーゼ阻害	○	○	?	○	ASO・TAO
エイコサペンタエン酸	トロンボキサンA <sub>2</sub> 生成阻害	×	△	△	?	ASO
PGE <sub>1</sub>	アデニレートシクラーゼ活性化	○	○	?	○	ASO・TAO 血行再建後の 血流維持
PGI <sub>2</sub> アナログ	アデニレートシクラーゼ活性化	○	○	?	○	ASO・TAO
アルガトロバン	トロンピン活性阻害	×	△*	?	×	TAO

×: 作用なし, △: 若干作用あり, ○: 作用あり, ?: 不明, \*: トロンピン刺激時のみ

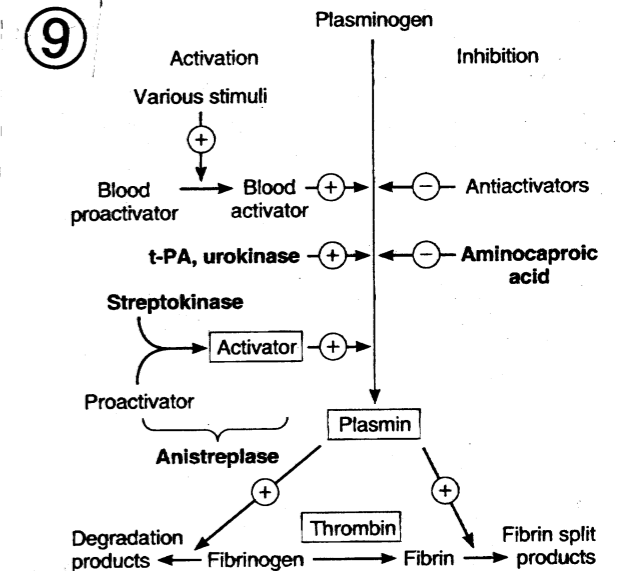
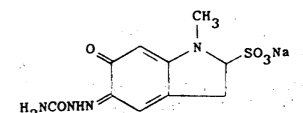


Figure 33-3. Schematic representation of the fibrinolytic system. Plasmin is the active fibrinolytic enzyme. Several clinically useful activators are shown on the left in bold. Anistreplase is a combination of streptokinase and the proactivator plasminogen. Aminocaproic acid (right) inhibits the activation of plasminogen to plasmin and is useful in some bleeding disorders.

1791. Carbazochrome Sodium Sulfonate. 5-[(Amino-carbonyl)hydrazono]-2,3,5,6-tetrahydro-1-methyl-6-oxo-1H-indole-2-sulfonic acid monosodium salt; 5,6-dihydro-1-methyl-5,6-dioxo-2-indolinesulfonic acid 5-semicarbazone sodium salt; epinochrome-2-sulfonic acid 5-monosemicarbazone sodium salt; 1-methyl-5-semicarbazono-6-oxo-2,3,5,6-tetrahydroindole-2-sulfonic acid sodium salt; sodium 5,6-dihydro-1-methyl-5,6-dioxo-2-indolinesulfonate 5-semicarbazone; Ac-17; Adenaron; Adona; Adrechros; Carbazon; Donasevin; Emex; Odanon; Tazin. C<sub>10</sub>H<sub>11</sub>N<sub>4</sub>NaO<sub>5</sub>; mol wt 322.29. C 37.27%, H 3.44%, N 17.38%, Na 7.13%, O 24.82%, S 9.95%. Prepn: Iwao, *Pharm. Bull. (Tokyo)* 4, 251 (1956), *C.A.* 51, 6860f (1957); *Brit. pat.* 795,184 (1958 to Gohei Tanabe). Revision of structure from a 3- to a 2-sulfonic acid: Kawazu *et al.*, *J. Heterocycl. Chem.* 10, 1059 (1973).



Yellow-orange needles from aq methanol, dec 227-228° (free acid dec 195°). Soluble in water. THERAP CAT: Hemostatic.