

1) カフェインの働き、主な副作用

カフェインは、脳に軽い興奮状態を引き起こす作用があり、眠気や倦怠感を一時的に抑える働きが期待される。脳が過剰に興奮すると、副作用として振戦（震え）、めまい、不安、不眠、頭痛を生じることがある。

眠気防止薬の薬効に関連しない作用として、カフェインは、腎臓での水分の再吸収を抑制するとともに、膀胱括約筋を弛緩させる働きがあり、尿量の増加（利尿）をもたらす。

安全使用の観点から留意すべき作用としては、胃液の分泌を亢進させる作用があり、副作用として胃腸障害（食欲不振、悪心・嘔吐）が現れることがある。胃酸過多の症状のある人、胃潰瘍の診断を受けた人は、服用を避ける必要がある。また、心筋を興奮させる作用もあり、副作用として動悸が現れることがある。心臓病の診断を受けた人は、服用を避ける必要がある。

さらに、カフェインには、作用は弱いものの、反復して摂取すると習慣になりやすい性質があることも知られており、コーヒーやお茶などの食品として摂取する場合に比べて、医薬品では、カフェインが凝縮された状態で容易に摂取可能であることから、「短期間の服用にとどめ、連用しないこと」と注意喚起がなされている。

妊娠中の眠気防止薬の使用が胎児に影響を及ぼすかどうかは明らかになっていないが、吸収されて循環血液中に移行したカフェインの一部は、胎盤関門を通過して胎児に到達することが知られており、胎児の心拍数を増加させる可能性がある。また、摂取されたカフェインの一部は、乳汁中にも移行するため、授乳期間中は食品等に含まれるカフェインと併せて、カフェインの総摂取量が継続して多くならないよう留意されることが望ましい。

なお、眠気を抑える成分ではないが、眠気による倦怠感を和らげる補助成分として、ビタミンB1（硝酸チアミン、塩酸チアミン等）、ビタミンB2（リン酸リボフラビンナトリウム等）、ビタミンB5（パントテン酸カルシウム等）、ビタミンB6（塩酸ピリドキシン等）、ビタミンB12（シアノコバラミン等）、ニコチン酸アミド、アミノエチルスルホン酸（タウリン）等が配合されている場合がある。これら成分に関する出題については、XⅢ（滋養強壮保健薬）を参照して作成のこと。

2) 相互作用、休養の勧奨等

【相互作用】 眠気防止薬におけるカフェインの1回摂取量はカフェインとして200mg、1日摂取量では500mgが上限とされている。カフェインは、他の医薬品（かぜ薬、解熱鎮痛薬、乗物酔い防止薬、滋養強壮保健薬等）や医薬部外品（ビタミン含有保健剤等）、食品（お茶、コーヒー等^{xxiv}）にも含まれている。それらを眠気防止薬と同時に摂取するとカフェインが過量となり、中枢神経系や循環器系等への作用が強ク現れるおそれがある。

^{xxiv} 100g中に含まれるカフェイン量の目安（五訂増補日本食品標準成分表による）
玉露：160mg、煎茶：20mg、ウーロン茶：20mg、紅茶：30mg、コーヒー：60mg

なお、かぜ薬やアレルギー用薬などを使用したことによる眠気を抑えるために、眠気防止薬を使用するのは適切でない。眠気が生じると不都合なときには、眠気を催す成分を含まない医薬品が選択されるべきであり、また、それらの医薬品には配合成分としてカフェインが含まれている場合も多く、重複摂取を避ける観点からも併用を避ける必要がある。

【休養の勧奨等】 眠気防止薬は、一時的に緊張を要するときに、眠気や倦怠感^{けん}を除去する目的で服用されるものであり、疲労を解消したり、睡眠が不要になるというものではない。睡眠不足による疲労には、早めに睡眠を摂ることが望ましい。特に内服液剤では、その製剤的な特徴（第2章Ⅱ-3）（剤型ごとの違い、適切な使用方法）参照。）から、本来の目的以外の意図で服用する不適正な使用がなされることがある。

細菌やウイルスなどに感染したときに生じる眠気は、発熱と同様、生体防御の重要な一端を担っている生理的反応であり（睡眠によって免疫機能が高まるとされる。）、そのようなときに眠気防止薬を使用して睡眠を妨げると、病気の治癒^ゆを遅らせるおそれがある。

十分な睡眠を摂っていても、眠気防止薬の使用では抑えられない眠気や倦怠感^{けん}（だるさ）が続くような場合には、神経、心臓、肺、肝臓等の重大な病気を示唆している可能性がある。また、睡眠時無呼吸症候群^{xxv}、重度の不安症や鬱病^{うつ}、ナルコレプシー^{xxvi}等の症状としての眠気も考えられるため、医療機関を受診することが望ましい。

成長ホルモンは生体を構築したり修復するのに重要なホルモンであるが、成長ホルモンの分泌を促す脳ホルモンは、ある種の睡眠物質と同時に分泌され、睡眠を促進することが知られている。すなわち、定期的な睡眠によって、生体を正常な状態に維持したり、成長が行われる。特に、成長期にある小児の発育には睡眠が重要であり、眠気防止薬に小児向けの製品はない。眠気防止薬が小・中学生の試験勉強に効果があると誤解され、誤用事故を起こした事例も知られており、15歳未満の小児に使用されることのないよう注意が必要である。

5 鎮暈薬^{うん}（乗物酔い防止薬）

めまい（眩暈^{げんうん}）は、体の平衡を感知して、保持する機能（平衡機能）に異常が生じて起こる症状であり、内耳にある平衡器官の障害や、中枢神経系の障害など、様々な要因により引き起こされる。乗物酔い防止薬は、乗物酔い（動揺病）によるめまい、吐き気、頭痛を防止し、緩和する目的で使用される一般用医薬品である。

1) 代表的な配合成分、主な副作用

抗めまい成分、抗ヒスタミン成分、抗コリン成分及び鎮静成分には、いずれも眠気を促す作用

xxv 睡眠中に一時的な呼吸停止又は低呼吸を生じる病気

xxvi 十分な睡眠を摂っていてもなお、突然に耐え難い眠気の発作が起こる病気

がある。抗コリン成分では、眠気を促すほかに、散瞳による目のかすみや異常なまぶしさを引き起こすことがある。乗物の運転操作をするときは、乗物酔い防止薬の使用を控える必要がある。

なお、乗物酔い防止薬には、主として吐き気を抑えることを目的とした成分も配合されるが、つわりに伴う吐き気への対処として使用することは適当でない。

(a) 抗めまい成分

塩酸ジフェニドールは、内耳にある前庭と脳を結ぶ神経（前庭神経）の調節作用のほか、内耳への血流を改善する作用を示す。抗ヒスタミン成分と共通する化学構造や薬理作用を持つが、抗ヒスタミン成分としてよりも専ら抗めまい成分として使用される。

副作用として、抗ヒスタミン成分や抗コリン成分と同様な頭痛、排尿困難、眠気、散瞳による異常な眩しさ、口渇のほか、浮動感や不安定感が現れることがある。排尿困難の症状がある人や緑内障の診断を受けた人では、その症状を悪化させるおそれがあり、使用する前にその適否につき、治療を行っている医師又は処方薬の調剤を行った薬剤師に相談がなされることが望ましい。

(b) 抗ヒスタミン成分

抗ヒスタミン成分は、延髄にある嘔吐中枢への刺激や内耳の前庭における自律神経反射を抑える作用を示す。また、抗ヒスタミン成分は抗コリン作用を示すものが多いが、抗コリン作用も乗物酔いによるめまい、吐き気等の防止・緩和に寄与すると考えられている。

ジメンヒドリナートは、テオクル酸ジフェンヒドラミンの一般名で、専ら乗物酔い防止薬に配合される抗ヒスタミン成分である。

塩酸メクリジンは、他の抗ヒスタミン成分と比べて作用が現れるのが遅く持続時間が長く、これも専ら乗物酔い防止薬に配合されている。

テオクル酸プロメタジン等のプロメタジンを含む成分については、外国において、乳児突然死症候群や乳児睡眠時無呼吸発作のような致命的な呼吸抑制を生じたとの報告があるため、15歳未満の小児では使用を避ける必要がある。

このほか、乗物酔い防止に配合される抗ヒスタミン成分としては、マレイン酸クロルフェニラミン、サリチル酸ジフェンヒドラミン等がある。抗ヒスタミン成分に共通する副作用等に関する出題については、Ⅶ（アレルギー用薬）を参照して作成のこと。

(c) 抗コリン成分

抗コリン作用を有する成分は、中枢に作用して自律神経系の混乱を軽減させるとともに、末梢では消化管の緊張を低下させる作用を示す。抗コリン成分に共通する副作用等に関する出題については、Ⅲ-3（胃腸鎮痛鎮痙薬）を参照して作成のこと。

臭化水素酸スコポラミンは、乗物酔い防止に古くから用いられている抗コリン成分で、消化管からよく吸収され、他の抗コリン成分と比べて脳内に移行しやすいとされるが、肝臓で速やかに代謝されてしまうため、抗ヒスタミン成分等と比べて作用の持続時間は短い。スコ

ポラミンを含む成分としてロートエキスが配合されている場合もある。

(d) 鎮静成分

乗物酔いの発現には不安や緊張などの心理的な要因による影響も大きく、それらを和らげることを目的として、ブロムワレリル尿素、アリルイソプロピルアセチル尿素のような鎮静成分が配合されている場合がある。鎮静成分に共通する副作用等に関する出題については I-3（眠気を促す薬）を参照して作成のこと。

(e) 中枢神経系を興奮させる成分（キサンチン系成分）

脳に軽い興奮を起こさせて平衡感覚の混乱によるめまいを軽減させることを目的として、カフェイン（無水カフェイン、クエン酸カフェイン等を含む。）やジプロフィリンなどのキサンチン系と呼ばれる成分が配合されている場合がある。カフェインには、乗物酔いに伴う頭痛を和らげる作用も期待される。

なお、カフェインが配合されているからといって、抗めまい成分、抗ヒスタミン成分、抗コリン成分又は鎮静成分の作用による眠気が解消されるわけではない。カフェインに関する出題については、I-4（眠気を防ぐ薬）を参照して作成のこと。

カフェイン以外のキサンチン系成分に関する出題については、II-1（咳止め・痰を出しやすくする薬）を参照して作成のこと。

(f) 局所麻酔成分

胃粘膜への麻酔作用によって嘔吐刺激を和らげ、乗物酔いに伴う吐き気を抑えることを目的として、アミノ安息香酸エチルのような局所麻酔成分が配合されている場合がある。

アミノ安息香酸エチルに関する出題については、III-3（胃腸鎮痛鎮痙薬）を参照して作成のこと。乗物酔い防止薬においても、アミノ安息香酸エチルが配合されている場合には、6歳未満の小児への使用は避ける必要がある。

(g) その他

吐き気の防止に働くことを期待して、塩酸ピリドキシン、ニコチン酸アミド、リボフラビン等のビタミン成分が補助的に配合されている場合がある。これら成分に関する出題については、XIII（滋養強壮保健薬）を参照して作成のこと。

2) 相互作用、受診勧奨等

【相互作用】 抗ヒスタミン成分、抗コリン成分、鎮静成分、カフェイン類等の配合成分が重複して、鎮静作用や副作用が強くなり現れるおそれがあるので、かぜ薬、解熱鎮痛薬、催眠鎮静薬、鎮咳去痰薬、胃腸鎮痛鎮痙薬、アレルギー用薬（鼻炎用内服薬を含む。）等との併用は避ける必要がある。

カフェイン類が配合されている場合の留意点については I-4（眠気を防ぐ薬）を参照して問題作成のこと。

【受診勧奨等】 3歳未満では自律神経系が未発達であるため、乗物酔いが起こることはほとんどないとされている。乗物酔い防止薬に3歳未満の乳幼児向けの製品はなく、そうした乳幼児が乗物で移動中にむずがるような場合には、気圧変化による耳の痛みなどの他の要因が考慮されるべきであり、乗物酔い防止薬を安易に使用することのないよう注意される必要がある。

乗物酔いに伴う一時的な症状としてでなく、日常においてめまいが度々生じる場合には、基本的に医療機関を受診することが望ましい。その場合、動悸や立ちくらみ、低血圧などによるふらつきは、平衡機能の障害によるめまいとは区別される必要がある。高齢者は、平衡機能の衰えによってめまいを起こしやすく、聴覚障害（難聴、耳鳴り等）に伴って現れることも多い。

6 小児の疳^{かん}を適応症とする生薬製剤・漢方処方製剤（小児鎮静薬）

小児では、特段身体的な問題がなく、基本的な欲求が満たされていても、夜泣き、ひきつけ、疳^{かん}の虫等の症状が現れることがあり、他者との関わり等への不安や興奮から生じる情緒不安定・神経過敏が要因のひとつといわれ、また、睡眠のリズムが形成されるまでの発達の一過程とも考えられている。授乳後にげっぷが出なかったり、泣く際に空気を飲み込んでしまうなどして、消化管に過剰な空気が入ることと関連づけられることもある。乳児は食道と胃を隔てている括約筋が未発達で、胃の内容物をしっかり保つておくことができず、胃食道逆流に起因するむずがり、夜泣き、乳吐きなどを起こすことがある。

小児鎮静薬は、それらの症状を鎮めるほか、小児における虚弱体質、消化不良などの改善を目的として使用される一般用医薬品（生薬製剤・漢方処方製剤）である。症状の原因となる体質の改善を主眼としているものが多く、比較的長期間（1ヶ月位）継続して服用されることがある。その場合に共通する留意点に関する出題については、XIV（漢方処方製剤・生薬製剤）を参照して作成のこと。

なお、身体的な問題がなく生じる夜泣き、ひきつけ、疳^{かん}の虫等の症状については、成長に伴って自然に治まるのが通常である。発達段階の一時的な症状と保護者が達観することも重要であり、小児鎮静薬を保護者側の安眠等を図ることを優先して使用することは適当でない。小児（特に乳幼児）への医薬品の使用に関する留意点については、第1章 II-4）（小児、高齢者などへの配慮）を参照して問題作成のこと。

1) 代表的な配合生薬等、主な副作用

小児の疳^{かん}は、乾という意味もあるとも言われ、痩せて血が少ないことから生じると考えられており、鎮静作用のほか、血流を改善する効果があるとされる生薬成分を中心に配合されている。いずれも古くから伝統的に用いられているものであるが、購入者等が、「作用が穏やかで小さな子供に使っても副作用が無い」などといった安易な考えでを使用することを避け、適切な医薬品を選択することができるよう、積極的な情報提供を行うことに努める必要がある。