

薬物の投与方法による特徴

- 薬物を投与すると、血液またはリンパ液を介して全身に分配される。投与方法によって血中への移行速度が異なる。

表1-6 薬物の代表的な投与方法

投与方法	適用（吸収）部位	期待される作用	初回通過効果
経口投与	胃（小腸・胃）	全身作用（局所作用）	有
注射	皮下注射	全身作用（局所作用）	無
	筋肉内注射		
	静脈内注射		
	動脈内注射	局所作用（全身作用）	
口腔粘膜投与	舌下（口腔内粘膜）	全身作用（局所作用）	無
吸入	気道（気道粘膜・肺胞上皮）	局所作用（全身作用）	無
直腸内投与	直腸内（直腸粘膜）	全身作用（局所作用）	無（一部有）
外用	皮膚・粘膜	局所作用（全身作用）	無

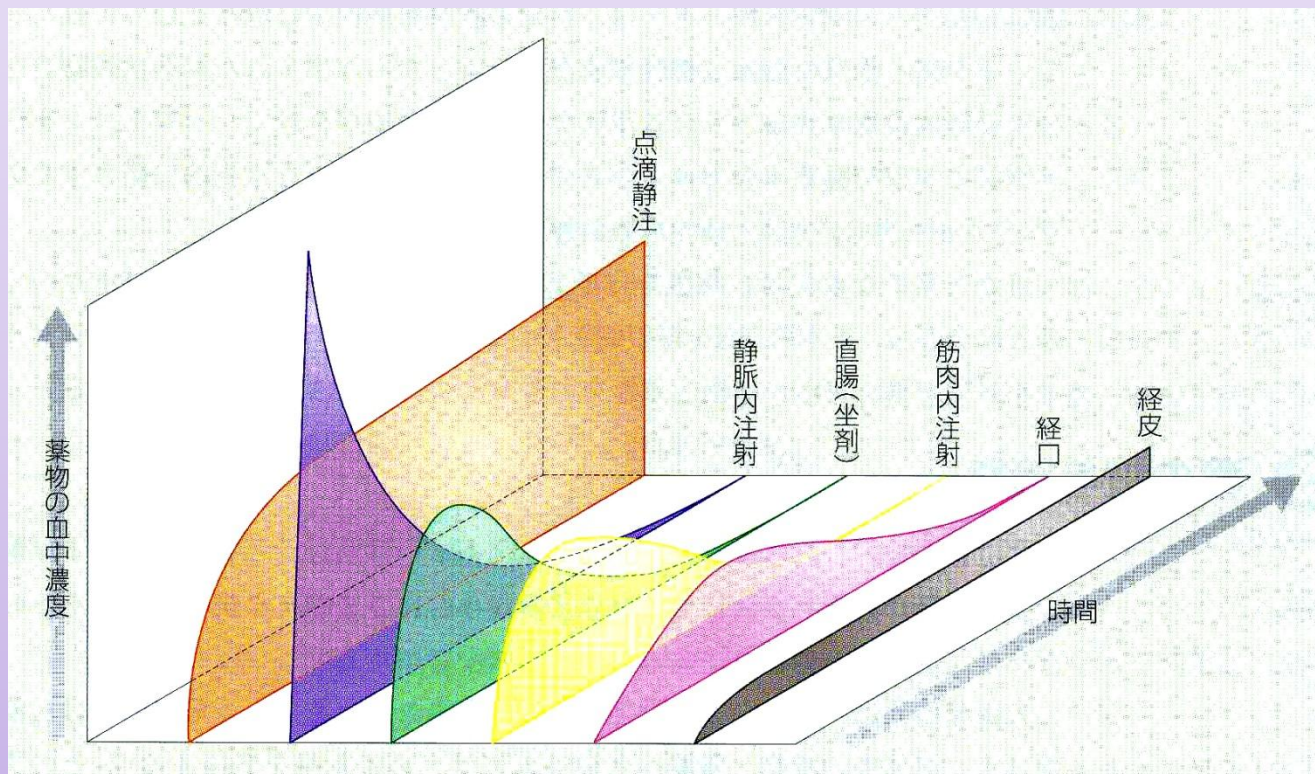
薬物の投与経路と血中濃度

吸収速度:

静脈内投与 > 直腸内投与 > 筋肉内投与 > 皮下投与 > 経口投与

持続性:

点滴静注 > 経皮(皮膚塗布) > 経口投与 > 皮下投与 > 筋肉内投与 > 直腸内投与



ポイント

直腸内投与は、直腸内粘膜から吸収され下大静脈を経て直接全身循環に入る。すなわち、初回通過効果を受けない。

経口投与

薬物を口から内服する方法である。

大部分の薬物は**小腸**で吸収される。

薬物が、胃・小腸で溶液状態となり、**消化管粘膜**という生体膜を**トランスポーター**を介して通過するのである。

多くの薬物は、**受動輸送**により吸収される。

大部分の薬物は、小腸から吸収され**門脈**血液の中に入り、**肝臓**を介して大静脈という体循環血液中に到達し吸収過程が終了する。

薬物は、**小腸粘膜上皮細胞**および**肝臓**に存在する酵素(**薬物代謝酵素:CYP**)により、少なからず**代謝・分解**されてしまう。

この現象を**初回通過効果**と呼ぶ。初回通過効果を受けやすい薬物を経口投与すると、大部分が薬理活性をもたない**代謝物**として循環系に入るため、十分な治療効果を期待できない。

経口投与の利点と欠点

〈利点〉

- ・服用が容易である。
- ・比較的安全に適用できる。
- ・作用が持続する製剤を作りやすい(徐放錠など)。

〈欠点〉

- ・消化管で分解される薬物は適用が難しい。
- ・初回通過効果を受ける。
- ・薬物の効果が現れるのに時間がかかる。
- ・胃内容排出時間により吸収が変化する。
- ・消化液の量や胃内pHなど生体の条件により吸収が変化する。

口腔内投与

口腔・咽頭の粘膜から薬物を吸収させる方法である。

(例：狭心症治療薬／ニトログリセリンの舌下錠)

口腔粘膜の下には**密な血管網**がある。脂溶性の高い薬物が吸収されやすい。口腔内投与において、薬物は吸収されて心臓に至る過程で**肝臓を通過しない**。すなわち、**肝臓での初回通過効果を受けない**利点がある。よって、ニトログリセリンのように肝臓で初回通過効果を受けることが多い薬物は、しばしば口腔内投与がなされる。

また、消化管内で分解されやすい薬物にも適用される。口腔内に投与する剤形としては、**舌下錠**、**エアゾール剤**が中心であり、速効性がある。**バツカル錠**と呼ばれる剤形は、口腔内で徐々に溶解し、持続的な効果を示す。バツカル錠は、自歯と頬の間に挿入し、唾液で徐々に溶解させて口腔粘膜から吸収させる製剤である。

口腔内投与の利点と欠点

〈利点〉

- ・初回通過効果を受けない。
- ・薬効の発現は速やかである。
- ・消化管で分解される薬物の適用が可能である。

〈欠点〉

- ・味によっては適用が難しい。
- ・刺激のある薬物は適用できない。

直腸内投与

坐剤(坐薬)として肛門から挿入し、直腸粘膜から薬物を吸収させる方法である。

薬物の内服が困難な悪心(嘔気)あるいは嘔吐症状があるときに適用となる。また、直腸内投与では、肝臓での初回通過効果をほとんど受けず、薬物の血中濃度が上がりやすい利点がある。そのため、疼痛・発熱などに対する消炎鎮痛薬の効果は、経口投与よりも直腸内投与のほうが大きい。消化管で分解される薬物が、直腸内投与では有効となるものがある。

直腸内投与の利点と欠点

〈利点〉

- 大部分は初回通過効果を受けない。
- 胃腸障害のある薬物の適用が可能である。
- 消化管で分解される薬物の適用が可能である。
- 経口投与できない患者に適用できる。

〈欠点〉

- 坐剤が押し出されることがあり、吸収が必ずしも一定しない。
- 不快感を訴える患者がいる。

直腸からの薬物吸収

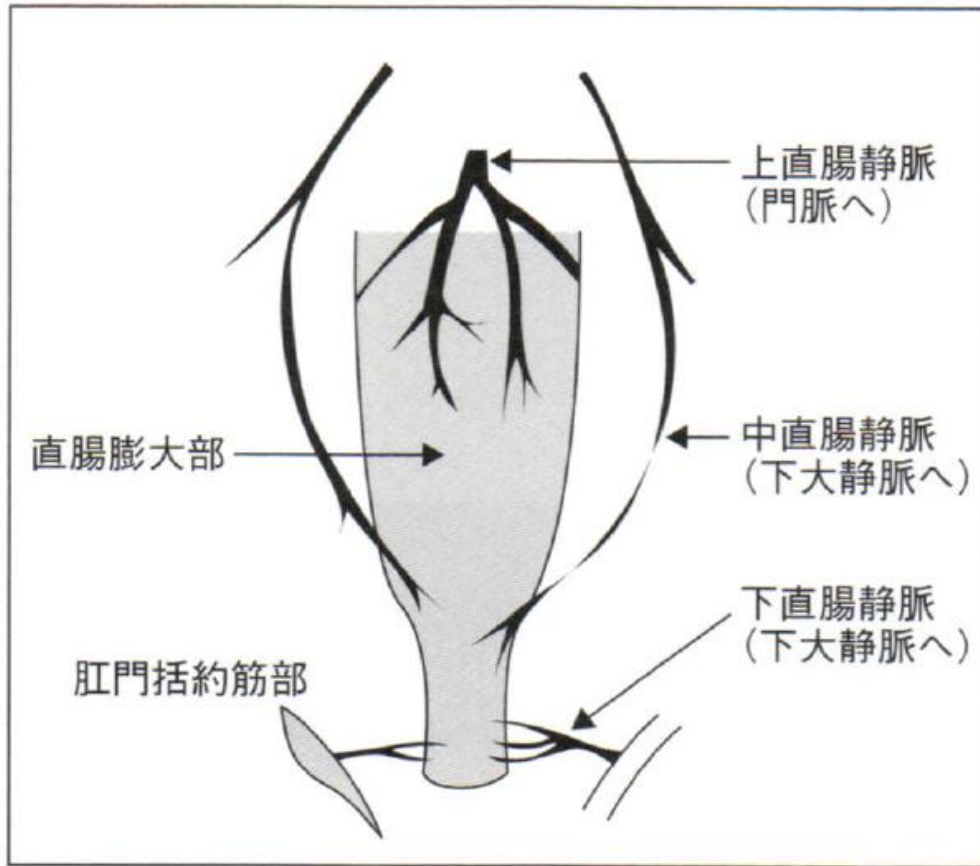


図 1-33 人の肛門および直腸部の静脈

薬物は直腸内で融解し速やかに吸収される。薬物の大部分は直腸中下部で吸収される。主に**中直腸静脈**あるいは**下直腸静脈**から**下大静脈**に入り、心臓に戻る。そのため、吸収された薬物の大部分は肝臓を通過せず、直接大循環(体循環)に入りほとんど初回通過効果を受けない。**上直腸静脈**に入った薬物は**門脈**より肝臓に入るので、初回通過効果を受ける。

吸入

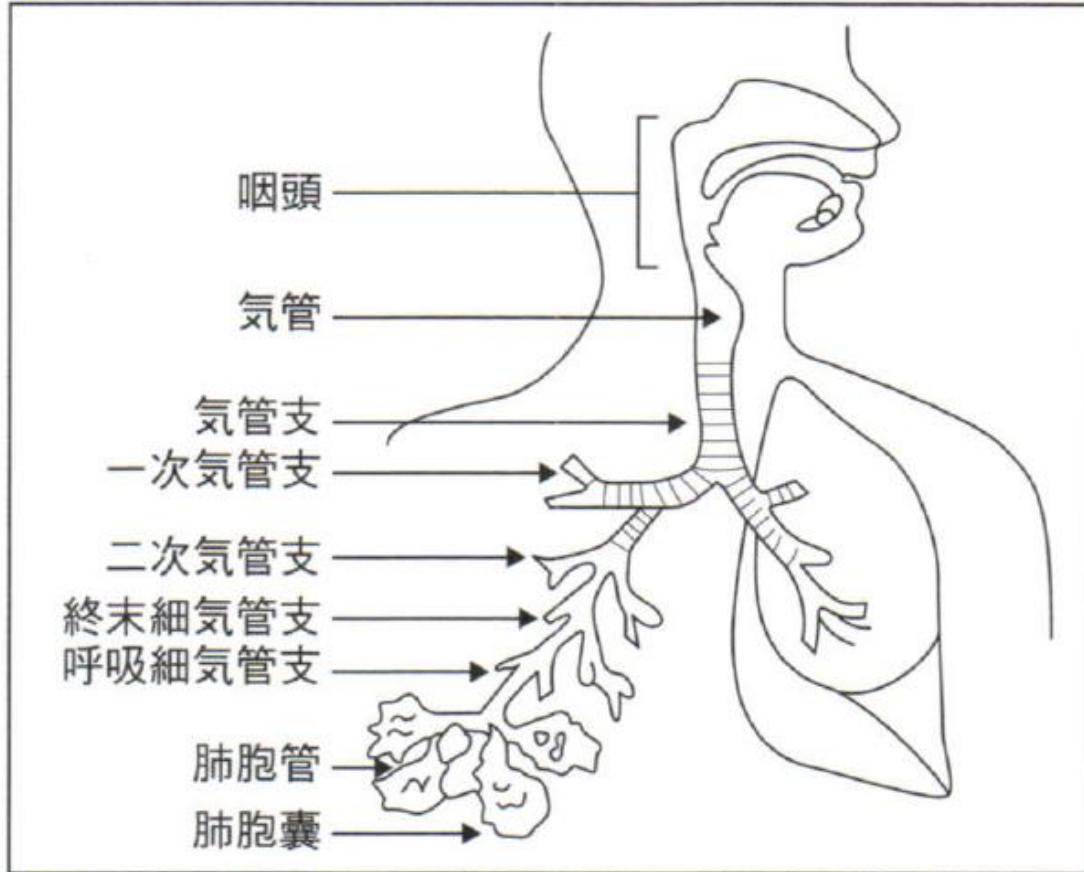


図 1-34 呼吸器の経路

気道に吸入し、鼻粘膜や肺胞から吸収させる方法である。鼻粘膜は毛細血管が発達している。肺胞は表面積がきわめて広く、血流量も多いので、薬物は速やかに吸収される(例:吸入麻酔、気管支喘息におけるステロイドや β 刺激薬)。吸入による薬物投与も、肝臓での初回通過効果を受けない。

経皮投与

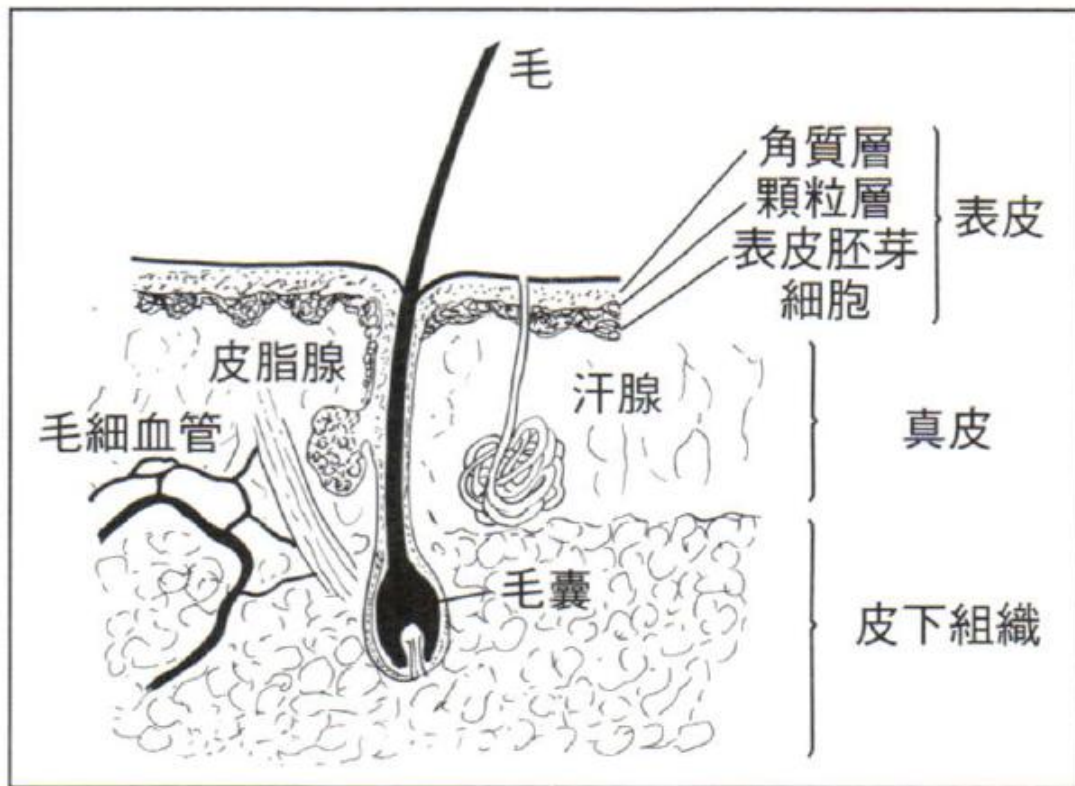


図1-35 皮膚の構造

皮膚は表皮、真皮および皮下組織からなり、薬物が表皮から真皮へと浸潤していき吸収される。表皮の最上層にある角質層が、薬物透過の障壁となる。角質層を通過することなく、皮膚の付属器である毛嚢、皮脂腺、汗腺からの吸収経路もある。しかし、これら付属器の面積は皮膚の1%にも満たないため、角質層を通しての吸収が経皮吸収の主な経路である。脂溶性の高い薬物が吸収されやすい。

薬物は直接体循環に入るため、初回通過効果を受けない。軟膏剤、クリーム、テープ剤、貼付薬などがある。ニトログリセリンや消炎鎮痛薬の貼付薬がよく用いられている。

経皮投与の利点と欠点

〈利点〉

- ・初回通過効果を受けない。
- ・一定の血中濃度が期待できる。
- ・投与後の中断が容易である。
- ・経口投与できない患者に適用できる。
- ・局所に高濃度の薬物を投与できる。
- ・適用面積を変えることにより投与量の調整が容易である。

〈欠点〉

- ・薬物の吸収が悪い。
- ・水溶性薬物には適用が難しい。

注射による投与法

注射剤は、**皮内、皮下、筋肉**または**血管**などを通して体内に直接適用される。血管内に投与される場合を除き、薬物は組織内に拡散し、受動輸送により毛細血管へ移行する。

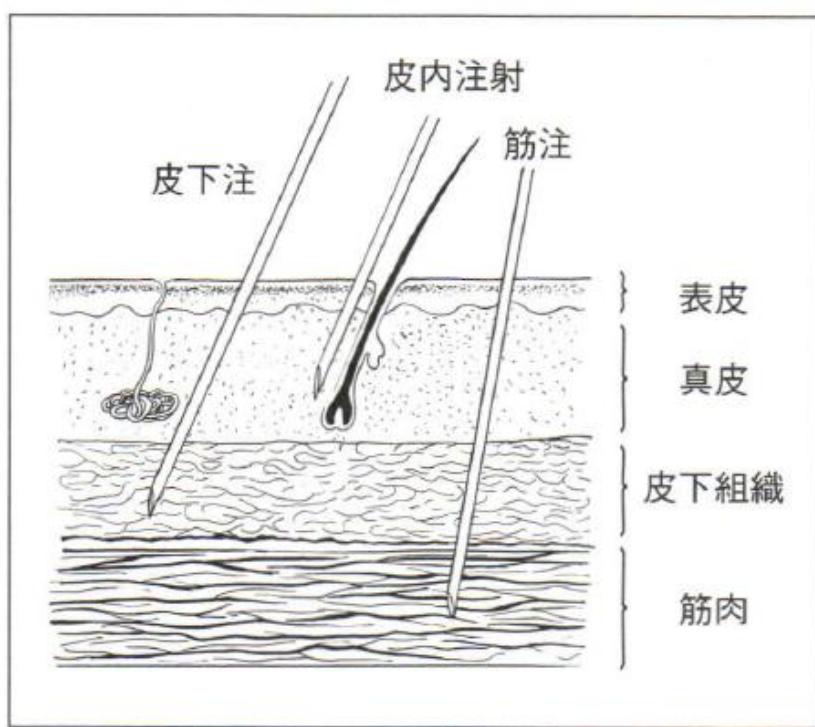


図 1-37 筋肉内注射，皮下注射，皮内注射

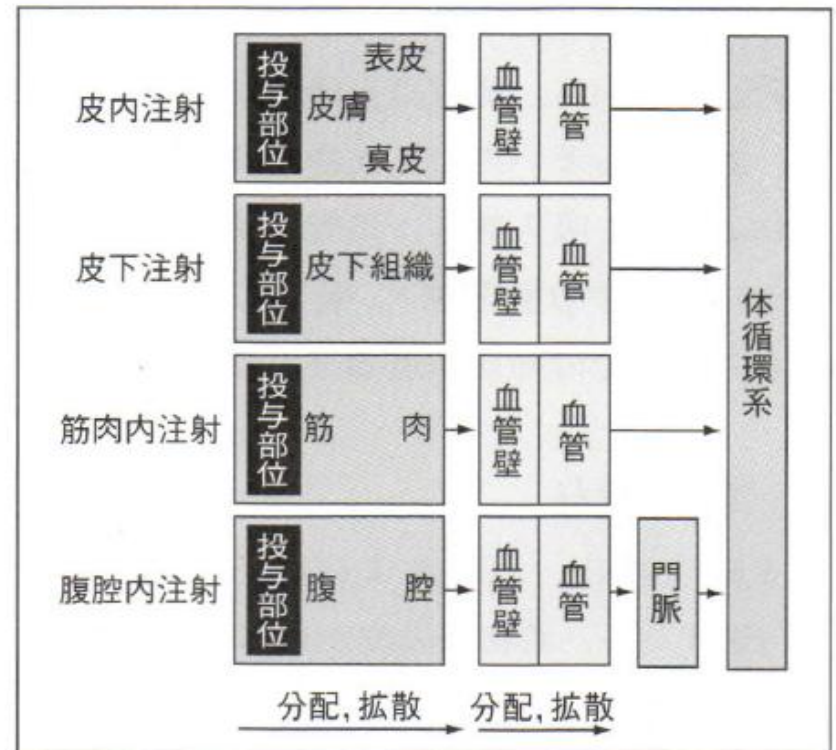
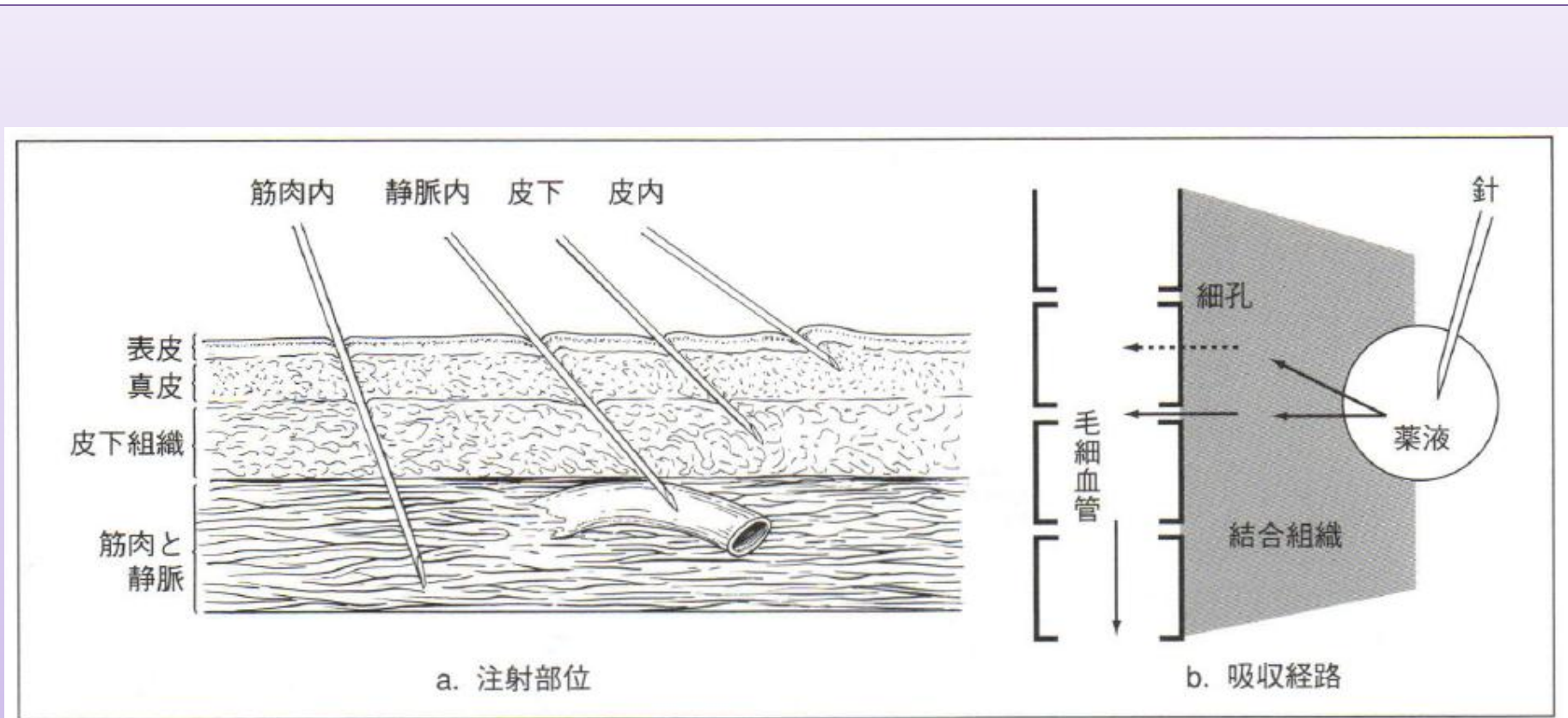


図 1-38 吸収経路

注射部位と吸収経路の模式図



注射の利点と欠点

〈利点〉

- ・初回通過効果を受けない。
- ・薬効の発現は速やかで確実である。
- ・消化管で分解される薬物の適用が可能である。
- ・経口投与できない患者に適用できる。

〈欠点〉

- ・注射部位に障害が生じることがある。
- ・投与後、薬物の血中濃度が急激に上昇し、中毒を起こすことがある。
- ・症状の発現が急激であるため、医療過誤を起こしやすい。

静脈内注射（静注）

静脈内注射は、薬物を直接静脈内に投与するため、投与直後に薬物の血中濃度は速やかに上昇する。

薬物投与量は少なくてよく、速効性がある。

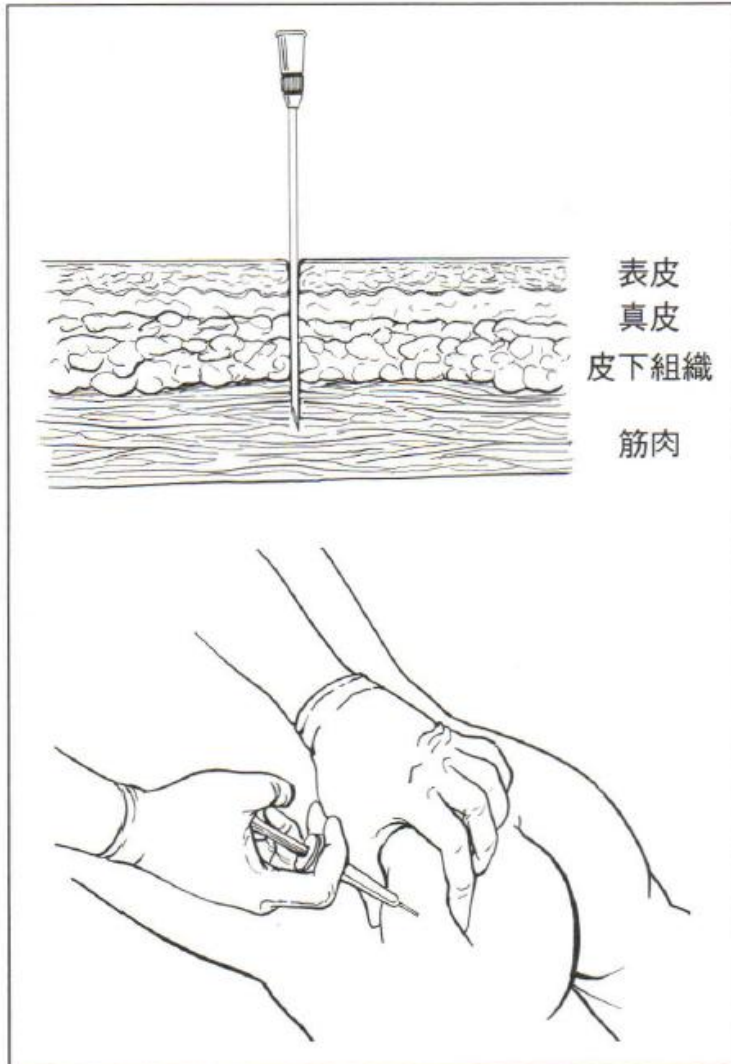
なお、注射薬の浸透圧やpHなどの関係で、静注可能な薬物と不可能あるいは許されていない薬物がある。

点滴静注

輸液のように投与量が多い場合は、点滴静注がなされる。末梢静脈からの注入と中心静脈からの注入がある。高濃度の糖と電解質を含み浸透圧が高い栄養輸液は、中心静脈路より行われることが多い。

点滴静注は、速度が速すぎると肺水腫・呼吸不全を起こす危険がある。とくに、心不全や腎不全のある高齢の患者で起こりやすい。そのような危険性が高いと考えられたときには、点滴速度を遅くする必要がある。

筋肉内注射



筋肉組織は毛細血管に富んでおり、薬物の血中移行は静注に次いで速い。局所刺激性の薬物でも皮下注射ほど疼痛を感じないものである。水に溶けない薬物でも乳剤や油性懸濁液として筋注することができる。吸収を遅くして、作用時間を長くすることも可能である。投与量は通常4ml以下である。**筋拘縮症**や注射部位の近くの神経障害を起こすことがあり、現在ではできるだけ避ける方向にある。

筋拘縮症:頻回の筋注で筋肉が線維化し、伸展性を失うために生じる疾病。大腿四頭筋拘縮症などが問題。

図 1 -36 筋肉内注射法

皮下投与

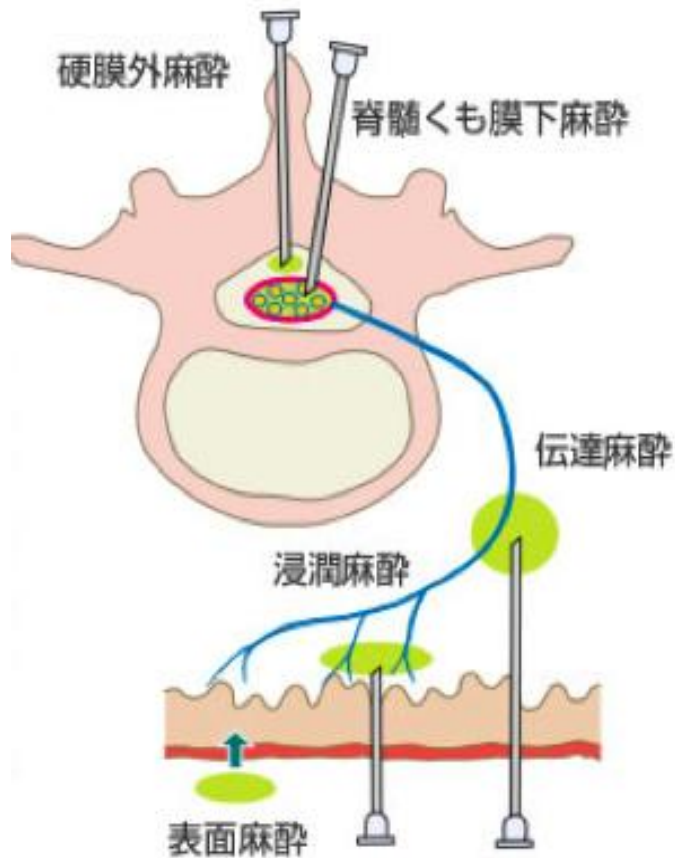
皮下組織への注射である。皮下組織は毛細血管が比較的少なく、静注、筋注に比べて薬物の血中移行は遅い。刺激性の強い薬物や酸性・アルカリ性の強い薬物には適さない。注射部位の疼痛、組織の壊死を起こす。

インスリンは皮下注射が一般的である通常、体液と等張の水溶液で、投与量は1ml以下の投与が望ましい。5ml程度までは投与が可能である。

皮内注射

皮膚の真皮内に薬液を注入する方法である。予防接種や、アレルギー反応を調べる目的などに用いられる(例:ツベルクリン反応)。真皮内は毛細血管が少なく、薬液の吸収される速度は遅い。皮下注射よりも、血中濃度の立ち上がりはかなり遅い。投与量は通常0.1~0.2mlと少量である。

髄腔内注射（脊髄腔内注射）



脊髄くも膜下腔内の髄液中に薬物を注入する方法である。

局所麻酔薬（リドカインなど）を注入し、下半身の運動・感覚神経を麻痺させての**腰椎麻酔**はよく用いられている。

動脈内注射

- 薬物の効果を特定の組織や臓器に限定する場合に用いられる。
- 目的とする組織・臓器の支配動脈に注入する方法である。動脈内にカテーテルを入れ造影剤や抗癌剤を注入することにより、診断や治療に用いられている。
- 例えば、肝癌に対して肝動脈に**抗癌剤注入**がなされる。