



### 薬についてのお話

## 決められたタイミング・量で飲むのはなぜ？

#### 【剤型（ざいけい）】

薬には様々な剤型がありますが、いずれも吸収され、血液に入り、全身を巡り効果を示します。その後、肝臓や腎臓で分解・解毒され、尿として排泄されます。飲み薬は腸で吸収され、血液に入りますが、まず肝臓に運ばれて代謝され、効果が一定の割合で減少してしまいます（初回通過効果）。どの程度減少するかは個々の薬で異なります（生物学的利用率）。吸入、舌下錠、貼付薬、座薬等は同様に吸収され、血液に入りますが、最初に肝臓を通過しないため、代謝されずに全身を循環します（生物学的利用率が高い）。この初回通過効果を想定し、肝臓を通過してから効果を発揮するように設計された薬もあります（プロドラッグ）。

#### 【血中薬物濃度】

薬が血液に入ると血中濃度が上昇しますが、適切な効果を発揮するには、一定の濃度を上回る必要があります（有効血中濃度）。人体の 70%は水分ですが、その中には幾つかの区画があり、血液はその 1 つです。摂取した薬が分布できる区画は薬によって決まっています。血液のみならず、広い区画に分布するのであれば、“組織移行性がよい薬”といわれます。言い換えると薬が溶けうる水分の容積（分布容積）が大きいと表現されますが、広く分布するため、投与後も長時間血中濃度を保てますが、排泄は遅い。また、排泄能力が低下すると、作用時間が長くなり、血中濃度も上がりやすくなります。



水 1L に薬 10mg が溶けた場合、濃度は 10mg/L です。これを变形し、投与薬物量 ÷ 血中薬物濃度を計算すると、薬が溶けている水の容積となり、これが分布容積となります。分布容積は薬ごとで異なり、大きい場合は、体に広く分布しているということを示します、つまり、分布容積は組織移行性の指標となります。血中濃度は様々な要因で変化します。血液に入った薬の一部は、蛋白質と結合する蛋白結合型と、結合しない遊離型に分かれます。薬の効果を発揮するのは遊離型の

みで、蛋白結合型は薬としての効果はなく、肝臓で代謝も受けず、また腎臓から排泄もされづらいです。そのため、蛋白質との結合率や蛋白質の状態も、有効性や代謝・排泄において重要です。

#### 【排泄】

上昇した血中濃度は何もしなければ徐々に低下し、いずれ 0 になります。血中濃度が半分になるまでの時間を半減期といい、個々の薬で異なります。治療効果を得るには、有効血中濃度を上回り、かつ、維持する必要があります。お風呂の給水と排水のスピードが釣り合っている状態を想像してください。服用の間隔より半減期が短ければ、服用直前の血中濃度は 0 のため、服用直前では効果は切れています。逆に、服用の間隔より半減期が長ければ、徐々に薬物は蓄積していくため、有効血中濃度に達するまで、服用を続ける必要があります。血中濃度が安定するまでは（定常状態）、半減期の 4~5 倍程度の時間がかかります。逆に、有効血中濃度の 1/10 になると効果はなくなるため、半減期の 4 倍、服用を中止すれば効果は消失します。ただし、高齢者、肝臓や腎機能障害を有する場合は代謝排泄過程が障害されており、用法用量の調整が必要かもしれません。有効性と安全性を守るために、用法用量を守って内服されるとよいと思います。



#### 一筆者紹介一

ふじい としはる  
**藤井 敏晴**



1978 年生 神奈川県出身  
 2004 年 東海大学医学部卒業  
 東海大学医学部医学科内科学系 循環器内科 講師  
 所属学会：日本内科学会 日本循環器学会  
 日本心血管インターベンション治療学会  
 日本脈管学会 日本糖尿病学会  
 日本心臓リハビリテーション学会  
 日本下肢救済・足病学会