

錠剤を内服することも奥が深い

帝京大学医学部薬理学 中木敏夫

カルシウム拮抗薬のニフェジピンという薬があります。高血圧、安静狭心症、不整脈の治療に使われている薬です。狭心症発作の緩解のために速効性を期待する場合には、通常の錠剤をかみ砕き、口の中に含むか飲み込ませることもできる、とされています。口の中に含んだ場合には口腔粘膜から吸収されます。飲み込んだ場合には小腸から吸収され肝臓を通過します。幸いなことにニフェジピンは初回通過効果は大きくありませんので、いずれでもよいとされているわけです。ところで、この薬は通常の錠剤だけでなく、徐放用の錠剤があります。カルシウム拮抗薬を高血圧の治療に使う場合には、作用時間が長い徐放タイプを使うほうが良いことになっています。急性心筋梗塞や安静狭心症の患者を対象にした多くの研究を総合的に調査したところ、カルシウム拮抗薬の通常タイプの用量が多い群では、死亡率がかえって増加することがわかっています。また、高齢者の高血圧患者では、ニフェジピン投与群の生存率は他の降圧薬投与群と比べてむしろ低かったという研究結果もあります。徐放タイプではこのようなことはないので、原因ははっきりしませんが、一つの可能性はコンプライアンスに関係があるといわれています。ニフェジピンは投与を急に中止するとかえって虚血性心疾患の症状が悪化することがわかっており、患者さんが薬を飲むことを忘れてしまうと、はからずも急激な投与中止と同じ効果を生んでしまうわけです。徐放タイプの錠剤を細かく砕いてしまうと徐放効果がなくなり通常の錠剤と同じことになってしまうので、砕いて口の中に含むなどという行為は危険な行為といえるでしょう。

オメプラゾールという消化性潰瘍の薬があります。これは胃粘膜の壁細胞に存在するプロトン(H⁺)ポンプに結合して酵素活性を阻害し、酸分泌を阻害する作用を利用したものです。オメプラゾールは錠剤です。錠剤をそのまま内服すれば問題はありません。オメプラゾールは酸で失活してしまう性質があるため、胃を通過するときには胃液に接しないように表面が腸溶性フィルムコーティングされており、腸に入ってから表面のコーティングが溶けてオメプラゾールが露出されるようになっています。もし、細かく砕いて内服した場合にはどうでしょうか。細かく砕いてしまうと、コーティングが壊れてしまい、オメプラゾールが胃を通過する際に胃酸により破壊されて、薬効を失ってしまいます。このため、患者さんには、かみ砕いてはいけないように指導する必要があります。他にも腸溶性フィルムコーティングされている薬は、抗結核薬のエチオナミド、ビタミン

ン B2 などの製剤があります。

腸溶性以外にもフィルムコーティングされている錠剤は少なくありませんが、その理由は様々です。例えばリン酸ペンブロペリンという非麻薬性鎮咳薬がありますが、フィルムコーティングされている理由は、これが口腔粘膜に触れるとしびれ感を来すからです。錠剤は咬まずに内服しておれば安心かという点、少数ですが例外があります。マクロライド系抗生物質のエリスロマイシンにはフィルムコートされた錠剤（お化粧した錠剤）とコートされていない素錠（すっぴんの錠剤）があります。普通の素錠は単純に飲み込めばよいのですが、エリスロマイシンの場合は飲み込むのではなく、口中で溶かすか、かみ砕いて服用することとなっています。これを咀嚼錠と言いますが、通常、幼児用です。エリスロマイシンに咀嚼錠が用意されている理由は、幼児のマイコプラズマ肺炎にはエリスロマイシンが第一選択薬であるからです。

さらに極端な例としては内服しない錠剤があります。膣トリコモナスに使うメトロニダゾールは内服用錠剤と膣錠があります。メトロニダゾール以外の成分が異なり膣錠を内服することは出来ません。膣錠は内服用のもの（直径約 1.0cm）よりも大きく直径が約 1.5cm もあり、さらに中心部分がへこんでいますので何か変な錠剤だなと気づくはずですが間違えないようにしたいものです。

個々の添付文書に記載されているので、目を通すことが必要でしょう。