

問2 薬物動態に関する記述として正しいのはどれか。[オリジナル]

- ① 半減期が3日の薬物の血中濃度が1/8になるには6日かかる。
- ② 猫は肝臓においてアセチル化抱合能がない。
- ③ 初回通過効果の影響を受けるのは、経口投与である。
- ④ 肝臓におけるシトクロムP450は基質特異性が高い。
- ⑤ 経口投与は静脈内投与に比べて速やかに血中濃度が上昇する。

◆薬理学 ～薬物動態～

・投与方法の特徴

①[]() ※初回通過効果[]

…血中濃度の上昇は速やか、投与の際に痛みを伴う
感染のリスクがある

②[]() ※初回通過効果[]

…脂溶性の薬物の投与も可能、痛みを伴う

③[]() ※初回通過効果[]

…刺激性の薬物の投与は推奨されない

④[]() ※初回通過効果[]

…簡便で、過程での投与が可能、血中濃度の上昇は緩やか

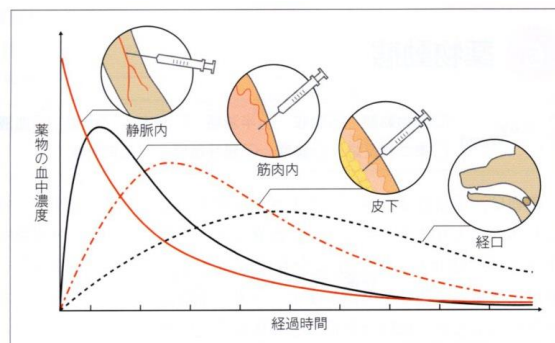


図9 投薬法と薬物の血中濃度の推移
薬物の血中濃度が一番早くピークに達するのは静脈内投与で、ついで筋肉内投与、皮下投与、経口投与の順である。

※初回通過効果

- ・薬物は、消化管から吸収されると門脈を介して肝臓に運搬される
- ・吸収された薬物は肝臓で代謝を受け効力を失う
- ・代謝されずに残った薬物が効果を示す
- ・全身に到達する前に薬物が代謝されることを初回通過効果という

●体内での薬物動態(吸収→分布→代謝→排泄)

- ・ []…体内に入った薬物は代謝され、排泄されると血中濃度が低下する。血中濃度が半分に
なるまでの時間を『半減期』という

例)半減期3日の薬物の濃度が1/8になるのに要する時間は？

- ・ 静脈内投与では、投与された薬物の100%が利用できる(生物学的利用率高い)が、経口投与された場合いくつかの要因により投与された薬物の一部しか利用出来ない。経口投与において、生物学的利用率が高い薬物の特徴は、①[], ②[](吸収されやすい), ③胃における[](分解/不活化されない)の3つがある。

- ・ 吸収された薬物の多くは[]で代謝される。肝臓ではいくつかの反応により排泄しやすい様に形が変えられる。特に[]※という酵素の働きが重要である。

※動物種による違い

犬…[]がない, 猫…[]がない

- ・ []…胆汁中に排泄された薬物が腸管から吸収され、肝臓に戻り再び胆汁中に排泄される

シトクロムP450

- ・細胞内の小胞体に多く存在
- ・多くの分子種(タイプ)が存在する
- ・動物種により違いも存在
- ・活性部位にヘムを持つヘムタンパク質
- ・多くの遺伝子型があり人では57種類ある