

## ○全身作用型の点鼻剤について

点鼻剤は、日本薬局方にて鼻腔又は鼻粘膜に投与する製剤と規定され、点鼻粉末剤及び点鼻液剤に小分類されます（表①）。また、作用部位で分類すると局所作用を期待する製剤と経鼻吸収により全身作用を期待する製剤に分けられます。

鼻粘膜への局所作用を目的とする製剤は、鼻腔内の患部に直接作用するため、効果発現が速く、全身性の副作用が少ないという特徴から、鼻炎や鼻出血などの治療に使用されてきました。一方、全身作用を期待する製剤は、鼻粘膜が高分子物質に対する高い透過性を示すことから、ペプチドやタンパク質に代表されるバイオ医薬品の投与部位として使用されてきました。さらに近年では、簡便な操作で迅速に投与できる製剤として全身作用を期待する製剤の新薬開発が活発に行われています。

そこで今回、点鼻剤の全身作用における特徴と、全身作用型の点鼻剤の一覧について以下に紹介します。

**表 1 鼻に適用する製剤 (第十八改正日本薬局方より)**

8. 鼻に適用する製剤 Preparations for Nasal Application
<p>8.1 点鼻剤 Nasal Preparations</p> <p>(1) 点鼻剤は、鼻腔又は鼻粘膜に投与する製剤である。本剤には、点鼻粉末剤及び点鼻液剤がある。</p> <p>(2) 本剤は、必要に応じてスプレーポンプなどの適切な噴霧用の器具を用いて噴霧吸入する。</p> <p>(3) 本剤のうち、定量噴霧式製剤は、別に規定するもののほか、適切な噴霧量の均一性を有する。</p>
<p>8.1.1 点鼻粉末剤 Nasal Dry Powder Inhalers</p> <p>(1) 点鼻粉末剤は、鼻腔に投与する微粉状の点鼻剤である。</p> <p>(2) 本剤を製するには、通例、有効成分を適度に微細な粒子とし、必要に応じて添加剤と混和して均質とする。</p> <p>(3) 本剤に用いる容器は、通例、密閉容器とする。製剤の品質に湿気が影響を与える場合には、防湿性の容器を用いるか、又は防湿性の包装を施す。</p>
<p>8.1.2 点鼻液剤 Nasal Solutions</p> <p>(1) 点鼻液剤は、鼻腔に投与する液状、又は用時溶解若しくは用時懸濁して用いる固形の点鼻剤である。</p> <p>(2) 本剤を製するには、通例、有効成分に溶剤及び添加剤を加え、溶解又は懸濁し、必要に応じ、ろ過する。等張化剤、pH 調節剤などを用いることができる。</p> <p>(3) 用時溶解又は用時懸濁して用いる本剤で、その名称に「点鼻用」の文字を冠するものには、溶解液又は懸濁用液を添付することができる。</p> <p>(4) 本剤で多回投与容器に充てんするものは、微生物の発育を阻止するに足る量の適切な保存剤を加えることができる。</p> <p>(5) 本剤に用いる容器は、通例、気密容器とする。製剤の品質に水分の蒸散が影響を与える場合は、低水蒸気透過性の容器を用いるか、又は低水蒸気透過性の包装を施す。</p>

## 1. 点鼻剤の全身作用における特徴

鼻腔内投与は経口投与と比較して、薬物吸収が良好かつ速やかであること、肝初回通過を回避できることから、命の危険を伴う低血糖時やてんかん発作時の緊急性を要する製剤や肝初回通過効果の影響を受け易く経口投与が困難な薬物の代替投与部位として期待されています。さらに、非侵襲的で注射剤のような痛みを伴わず、経口製剤の服用が難しい患者への介護者による投与が可能です。この特徴は低血糖時のグルカゴン鼻腔製剤や、てんかん発作に対するジアゼパム鼻腔製剤といった在宅医療や自己投与が求められる場面で有用です。

## 2. 点鼻剤の使用上の注意点

点鼻剤は投与手技の不備により効果が得られないことのほか、薬物濃度が比較的高いまま維持され粘膜上に広がるため投与後の血中濃度の立ち上がりから過量投与の影響が大きいことが懸念されます。そのため薬剤の交付時には全身性の薬効を十分に発揮させたり、副作用を予防するために、患者への薬効・使用法の説明や点鼻手技の確認が非常に重要です。

### 3. 中枢神経系への直接送達の可能性

脳は血液脳関門（BBB）によって嚴重に保護されており、多くの薬物が BBB を通過できないため、中枢神経系疾患の治療薬の開発における障壁となっています。経鼻投与された薬物の一部は、全身循環を介さずに、鼻腔上部にある嗅上皮から嗅球を経由して脳に直接到達する経路、呼吸上皮から体内に取り込まれる経路に加え、呼吸上皮から三叉神経を介して脳幹に至る経神経細胞経路の存在が明らかとなっています。BBB を回避することで難治性の神経変性疾患（例：アルツハイマー病、パーキンソン病）や精神疾患（例：うつ病）に対する新規治療薬の開発に大きな期待が寄せられています。

### 4. 全身作用型の点鼻剤一覧

以下に、現在承認されている全身作用型の点鼻剤を薬効別に紹介します（表 2）。

表2 全身作用型経鼻製剤の一覧

分類	一般名	商品名	採用種別	適応・備考
ホルモン製剤	グルカゴン	バクスマー点鼻粉末剤3mg 	臨時	低血糖時の救急処置
	デスマプレシン 酢酸塩水和物	デスマプレシン 点鼻スプレー2.5μg「フェリング」 	正規	中枢性尿崩症 ・現在は経口製剤が広く使用されている
	ナファレリン 酢酸塩水和物	ナサニール点鼻液0.2% 	正規	子宮内膜症、子宮筋腫の縮小及び子宮筋腫に基づく下記諸症状の改善（過多月経、下腹痛、腰痛、貧血）、生殖補助医療における早発排卵の防止
	ブセレリン 酢酸塩	スプレキュア点鼻液0.15% 	非採用	子宮内膜症、中枢性思春期早発症、子宮筋腫の縮小及び子宮筋腫に基づく下記諸症状の改善（過多月経、下腹痛、腰痛、貧血）、生殖補助医療における卵胞成熟、生殖補助医療における早発排卵の防止
抗けいれん薬	ジアゼパム	スピジア点鼻液5mg 	非採用	てんかん重積状態 ・製造販売承認（2025年6月） 薬価収載（2025年10月） 発売予定日（未定）

分類	一般名	商品名	採用種別	適応・備考
片頭痛治療薬	スマトリプタン	イミグラン点鼻液20 	臨時	片頭痛 ・ 限定出荷（2025年9月～ 再開）
ワクチン	弱毒生 インフルエンザ ウイルス	フルミスト点鼻液 	正規	インフルエンザの予防
アナフィラキシー 補助治療剤	アドレナリン	ネフィー点鼻液1mg / 2mg 	非採用	蜂毒、食物及び薬物等に起因する アナフィラキシー反応に対する補助治療 オンライン登録講習を受講し、処方医師登録を することが必要  ・ 2025年9月製造販売承認 薬価基準未収載（2025年11月現在）

正規：正規採用薬  
非採用：非採用薬  
臨時：特定患者臨時

(参考資料)

- ・ 各種添付文書
- ・ 月間薬事 2011.11 (Vol. 53 No. 12) 特集-点鼻剤
- ・ 東京理科大学ホームページ  
( [https://www.tus.ac.jp/today/archive/20211124\\_8305.html](https://www.tus.ac.jp/today/archive/20211124_8305.html) )
- ・ 日薬理誌 148～152 (2017) 経鼻薬物送達の現状と将来  
より抜粋・加筆