

99-208

問題文

61歳男性。2日ほど前から左側腹部に軽度の疼痛があり、皮疹が認められた。帯状疱疹と診断され、以下の薬剤が処方された。なお、検査値を確認したところ、ASTは31IU/L、ALTは23IU/L、クレアチニンクリアランスは40mL/minであった。

(処方1)

バラシクロビル塩酸塩錠 556 mg^(注) 1回2錠 (1日6錠)
1日3回 朝昼夕食後 7日分

(注：バラシクロビルとして 500 mg)

(処方2)

アセトアミノフェン錠 300 mg 1回1錠 (1日3錠)
1日3回 朝昼夕食後 7日分

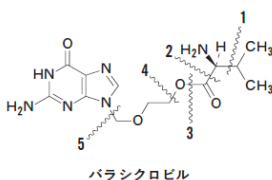
問208

これらの処方について、提案すべき処方変更として最も適切なのはどれか。1つ選べ。

1. バラシクロビル塩酸塩錠556mgの用法・用量を1回2錠(1日4錠)、1日2回、朝夕食後投与に変更する。
2. バラシクロビル塩酸塩錠556mgの用法・用量を1回3錠(1日9錠)、1日3回、朝昼夕食後投与に変更する。
3. バラシクロビル塩酸塩錠556mgをアシクロビル錠400mgに変更し、用法はそのままとする。
4. アセトアミノフェン錠300mgをロキソプロフェンナトリウム水和物錠60mgに変更し、用法はそのままとする。
5. アセトアミノフェン錠300mgをチアラミド塩酸塩錠100mgに変更し、用法はそのままとする。

問209

バラシクロビルは、加水分解によりアシクロビルに変換され活性を発現する。切断される位置はどれか。1つ選べ。



解答

問208：1問209：3

解説

問208

検査値の内、AST、ALT は正常であり、肝機能は問題ないと推測されます。クレアチニンクリアランスですが基準が大体 100 mL/min なのでかなり低く、腎機能が低下していることが伺えます。

処方において、バラシクロビルは抗ウイルス薬です。アシクロビルのプロドラッグです。消化管吸収が改善されています。経口投与後、アシクロビルに変換され、ウイルス感染細胞において活性化され DNA ポリメラーゼを抑制することによりウイルス増殖を阻止します。腎排泄の代表的な薬です。クレアチニンクリアランスに応じた投与量、間隔の調整が必要とされる薬です。

本問の患者であれば、1000 mg を 1 2 時間ごとが適切と考えられます。（添付文書 参照）

以上より、正解は 1 です。

問209

パラシクロピルは、アシクロピルにバリンをくっつけた、プロドラッグです。アシクロピルへの変換は、エステルの加水分解によりおきます。よって、3 の部分で切断されます。

以上より、正解は 3 です。

参考)

ちなみに補足ですが、この問題は構造式だけ見れば OK な問題といえます。すなわち選択肢 1 は、C - C 結合だから、そう簡単には切断しないから×。

選択肢 2 は、アミド結合部分で、アミドは安定だから、×。

選択肢 4は、C-O 結合で、エーテルは安定であることから、×。

選択肢 5 は、C-N 結合で、アミンのこの部分が切れるというのは馴染みがないから、× だろう。といった推測で、正解を導くことができる、と考えられます。

又、この問題は、切断された後の右上部分を隠して、この部分の構造は、以下の選択肢のうちどれか？という形で、アミノ酸（バリン）の構造式を正しく選ばせる問題 として再活用されるのではないかと個人的には推測した問いです。補足 以上。