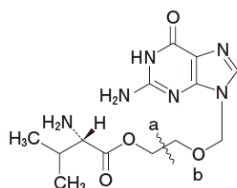


104-212

問題文



パラシクロビル

1. アシクロビルの脂溶性を増大させることを意図して創出されたプロドラッグである。
2. アシクロビルとL-バリンがエステル結合を介して連結した構造をもつ。
3. 生体内に存在する酵素の作用により、波線部aにおいて結合が切断される。
4. 生体内でbに示す酸素原子がリン酸化されることによって薬理活性を示す。
5. 小腸のペプチドトランスポーターを介して吸収される。

解答

問212：1, 4問213：2, 5

解説

問212

選択肢 1 は妥当な記述です。

パラシクロビル（バルトレックス）は、単純疱疹の場合 1回 500mg を 1 日 2 回投与です。単純疱疹は大きく口唇ヘルペスと性器ヘルペスに分類されます。

選択肢 2 ですが

テオフィリンとアシクロビルの併用で、機序不明ながらテオフィリンの血中濃度上昇が知られています。パラシクロビルはアシクロビルのプロドラッグです。そのため、代謝物との併用効果により、テオフィリンの中毒症状が現れる可能性があります。よって、選択肢 2 は誤りです。

選択肢 3 ですが

バイオアベイラビリティが高くなっているため、少なくとも「現れにくい」という記述は不適切と考えられます。よって、選択肢 3 は誤りです。

選択肢 4 は妥当な記述です。

選択肢 5 ですが

水泡消失までの時間短縮も期待できます。「水泡は消失することはない」という記述は不適切と考えられます。よって、選択肢 5 は誤りです。

以上より、問212 の正解は 1,4 です。

問213

選択肢 1 ですが

アシクロビル＋バリンのエステル結合がバラシクロビルです。意図は経口吸収性改善です。「脂溶性増大」が意図ではありません。よって、選択肢 1 は誤りです。

選択肢 2 は妥当な記述です。

選択肢 3,4 ですが

小腸ペプチドトランスポーターの一種である PEPT1 により吸収された後、肝臓で加水分解されて薬効発揮です。エステル加水分解なので、切断されるのはCOOの部分です。波線部 a ではありません。また、b の酸素原子がリン酸化されることによって活性化されるわけでもありません。よって、選択肢 3,4 は誤りです。

選択肢 5 は妥当な記述です。

以上より、問213 の正解は 2,5 です。