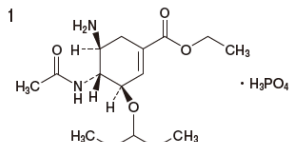


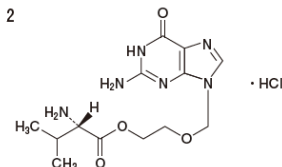
105-208

問題文

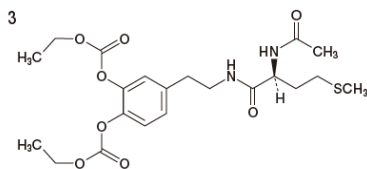
アプレピタントからホスアプレピタントが創製されたのと同様な目的で開発されたプロドラッグはどれか。1つ選べ。



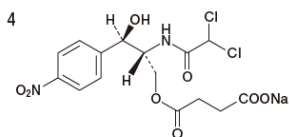
オセクタミビルリン酸塩



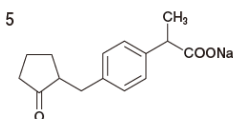
パラシクロビル塩酸塩



ドカルバミン



クロラムフェニコールコハク酸
エステルナトリウム



ロキシプロフェンナトリウム

解答

問208 : 3問209 : 4

解説

問208

ホスアプレピタントは、アプレピタント（経口剤）のプロドラッグです。注射剤です。投与後速やかにアプレピタントに変化します。経口投与が難しい患者さんのためのアプレピタント別製剤バージョンと考えるとよいです。そのため「血液脳関門を通過しやすくなっている」といった性質の変化はありません。

以上より、正解は3です。

問209

経口製剤に難があり、その改良のために別製剤が作られた というプロドラッグを選択肢から見つけてください、という問といえます。

選択肢1ですが

経口投与による吸収改善のために開発されたプロドラッグです。エステル部分が加水分解することにより活性代謝物となります。

選択肢2ですが

パラシクロビルは、アシクロビルのプロドラッグです。経口投与による吸収改善のために開発されたプロド

ラッグです。肝臓のエステラーゼで代謝されて薬効を示します。

選択肢 3 ですが

ドカルバミンは、ドバミンのプロドラッグです。カテコール基とアミノ基を修飾することで血漿中遊離型ドバミン濃度を効率的かつ持続的に上昇させることができる経口剤として開発されました。

選択肢 4 は妥当な記述です。

クロラムフェニコールコハク酸エステルナトリウムは注射剤です。クロラムフェニコール経口製剤には強い苦味があります。経口投与困難な患者のための注射製剤として開発されたと考えられます。

選択肢 5 ですが

ロキソプロフェンナトリウムは、消化管障害軽減を目的としたプロドラッグです。

以上より、正解は 4 です

参考)