

製剤関連・国試過去問2015 六年制

	97	98	99	100
1. 物質の溶解				
① 溶液の濃度と性質	○			○
② 物質の溶解とその速度	○	○○	○○	○○
③ 溶解した物質の膜透過速度	○○			
④ 物質の溶解に対して酸・塩基反応が果たす役割		○		○
2. 分散系				
① 界面の性質			○	○
② 代表的な界面活性化剤の種類と性質	○	○	○	○
③ 乳剤の型と性質	○	○		
④ 代表的な分散系とその性質				
⑤ 分散粒子の沈降現象				
3. 製剤材料の物性				
① 流動と変形(レオロジー)の概念、代表的なモデル			○	○
② 高分子の構造と高分子溶液の性質				○
③ 製剤分野で汎用される高分子の物性				
④ 粉体の性質	○○	○	○○	○○
⑤ 製剤材料としての分子集合体				
⑥ 薬物と製剤材料の安定性に影響する要因、安定化方法				
⑦ 粉末X線回折測定法の原理と利用法		○	○	
⑧ 製剤材料の物性の測定				
4. 代表的な製剤				
① 代表的な剤形の種類と特徴				
② 代表的な固形製剤の種類と性質		○	○○○	○○○
③ 代表的な半固形製剤の種類と性質	○	○		○○
④ 代表的な液状製剤の種類と性質				○
⑤ 代表的な無菌製剤の種類と性質	○	○	○	○○○○
⑥ エアゾール剤とその類似製剤		○		○○
⑦ 代表的な製剤添加物の種類と性質	○○○		○○	○
⑧ 代表的な製剤の有効性と安全性評価法		○		
5. 製剤化の方法				
① 製剤化の単位操作および汎用される製剤機械	○	○○	○	○○○
② 単位操作を組み合わせた代表的製剤の調製	○		○	
③ 汎用される容器、包装の種類や特徴	○	○		
6. 製剤試験法				
① 日本薬局方の製剤に関連する試験法	○			○
② 日本薬局方の製剤に関連する代表的な試験法、品質管理への適用	○	○		
7. DDSの必要性				
① 従来の医薬品製剤の有効性、安全性、信頼性における主な問題点				○○○
② DDSの概念と有用性				
8. 放出制御型製剤				
① 放出制御型製剤(徐放性製剤を含む)の利点	○○			
② 代表的な放出制御型製剤	○	○		○
③ 代表的な徐放性製剤における徐放化の手段		○		○
④ 徐放性製剤に用いられる製剤材料の種類と性質				
⑤ 経皮投与製剤の特徴と利点		○		○
⑥ 腸溶製剤の特徴と利点				
9. ターゲティング				
① ターゲティングの概要と意義			○○	
② 代表的なドラッグキャリアー、そのメカニズム	○○	○	○	
10. プロドラッグ				
① 代表的なプロドラッグ、そのメカニズムと有用性	○	○	○○	○
11. その他のDDS				
① 代表的な生体膜透過促進法				
② 代表的な組換え医薬品				

1. 物質の溶解

- ① 溶液の濃度と性質
- ② 物質の溶解とその速度
- ③ 溶解した物質の膜透過速度
- ④ 物質の溶解に対して酸・塩基反応が果たす役割

問174 硫酸亜鉛の容積価は 16.7 mL である。硫酸亜鉛の食塩価として最も近い値はどれか。

- 1 0.10 2 0.12 3 0.15 4 0.17 5 0.20

正解 3

第92回

問175 涙液と等張な 1.5 w/v% 硝酸銀溶液を 200 mL 調製するのに必要な硝酸カリウムの量(g)に最も近い値はどれか。ただし、硝酸銀の等張容積価(mL)は 36.7、硝酸カリウムの食塩当量(g)は 0.56 である。

- 1 0.6 2 0.8 3 1.0 4 1.2 5 1.4

正解 5

第86, 95回

問176 次の処方で体液と等張な塩酸エフェドリン液を調製するのに必要なブドウ糖の正しい量(g)はどれか。ただし、塩酸エフェドリン、クロロブタノール、ブドウ糖の食塩当量はそれぞれ 0.30、0.24、0.18 である。

処方	塩酸エフェドリン	0.60 g
	クロロブタノール	0.15 g
	ブドウ糖	<input type="text"/> g
	精製水	適量
全量		30 mL

- 1 0.10 2 0.20 3 0.30 4 0.40 5 0.50

正解 3

第88, 96回

問 178 ビロカルピン塩酸塩 1%点眼剤を 100 mL 調製するとき、等張化するのに 0.66 g の食塩を必要とした。ピロカルピン塩酸塩 3%点眼剤を 100 mL 調製するとき、等張化するのに要する食塩の量 (g) に最も近い値はどれか。1つ選べ。

- 1 0.09 2 0.18 3 0.36 4 0.48 5 0.60

第97回

正解 2

問 329 20%ブドウ糖液を調製して、末梢静脈から点滴投与する注射処方せんが発行された。薬剤師は高浸透圧による静脈炎が発生する可能性があるかと判断し、処方医に疑義照会した。20%ブドウ糖液の血漿に対する浸透圧比として最も近いのはどれか。1つ選べ。なお、血漿の浸透圧を 290 mOsm/L とし、ブドウ糖の分子量は 180 とする。

- 1 2.1 2 2.6 3 3.2 4 3.8 5 4.2

正解 4

(第 100 回)

問 170 Noyes - Whitney 式に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

$$\frac{dC}{dt} = k \cdot S \cdot (C_s - C)$$

C : 溶液中の溶質濃度、 C_s : 固体の溶解度、S : 表面積、

k : 見かけの溶解速度定数、t : 時間

- a 溶解過程が拡散律速の場合についてのみ成立する式である。
- b シンク条件 ($C \ll C_s$) についてのみ成立する式である。
- c 溶解速度定数 k の値は、溶解過程での攪拌条件により変化する。
- d 結晶性医薬品を数 μm 程度まで微細化すると、表面積の増大とともに C_s も著しく増大するため、溶解速度は顕著に大きくなる。

	a	b	c	d
1	正	正	誤	正
2	正	誤	正	正
3	正	誤	正	誤
4	誤	正	誤	正
5	誤	正	誤	誤

第93回

正解 3

問 95 低分子やイオンの水溶液中における拡散係数 D に関する記述のうち正しいのはどれか。2つ選べ。ただし、理想状態における拡散を仮定する。

- 1 D は水和による影響を受けない。
- 2 D は溶液の粘度に反比例する。
- 3 D は絶対温度に比例する。
- 4 D は溶質の半径に比例する。
- 5 D は溶質の濃度に比例する。

第99回

正解 2、3

問 49 一般に、薬物粉末の粒子径が小さいほど薬物の溶解速度が大きくなる理由として最も適切なのはどれか。1つ選べ。

- 1 飽和溶解度の増大
- 2 比表面積の増大
- 3 粒子表面の拡散層の減少
- 4 薬物分子の拡散係数の増大
- 5 飽和層と内部溶液の薬物濃度差の減少

第100回

正解 2

問168 ある固体薬物の結晶多形であるⅠ形とⅡ形は互変二形の関係にある。ファントホッフ式から求めたⅠ形の溶解熱は 28 kJ/mol、Ⅱ形の溶解熱は 21 kJ/mol であり、Ⅰ形とⅡ形の転移温度は 83℃であった。次の記述のうち、正しいものの組合せはどれか。ただし、温度 10℃ から 90℃ の間で溶解熱は変化しないものとする。

- a 37℃における溶解度はⅠ形<Ⅱ形である。
- b 37℃における溶解度はⅠ形>Ⅱ形である。
- c 37℃における溶解度はⅠ形=Ⅱ形である。
- d 83℃における溶解度はⅠ形=Ⅱ形である。
- e 90℃における溶解度はⅠ形<Ⅱ形である。

- 1 (a, d) 2 (a, e) 3 (b, d)
- 4 (b, e) 5 (c, e) 6 (d, e)

第91回

正解 1

問 169 次の表は薬物の溶解速度に影響する要因、その効果及びそれらによって溶解速度が改善された代表的な薬物名を示したものである。正しい組合せはどれか。

	要 因	効 果	薬 物 名
a	粒子径	小さくするほど溶解速度が大となる	グリセオフルビン
b	結晶多形	安定形ほど溶解速度が大となる	リボフラビン
c	無晶形	無晶形は、結晶形に比較し溶解速度が大となる	インスリン亜鉛
d	溶媒和	水和物は無水物より溶解速度が大となる	ニトログリセリン

- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d)
- 4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d)

第83, 92回

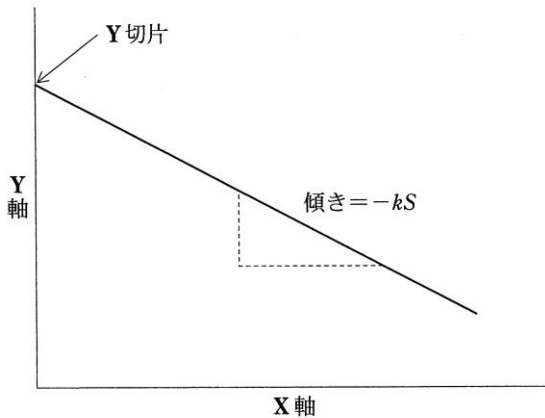
正解 2

問168 固体薬物 A は拡散律速によって溶解し、溶解速度は以下に示す Noyes-Whitney の式に従う。

$$dC/dt = kS(C_s - C)$$

dC/dt : 溶解速度、 k : 見かけの溶解速度定数、 S : 固体薬物 A の有効表面積、 C_s : 薬物 A の溶解度、 C : 溶液中の薬物 A の濃度

固体薬物 A を円盤状に圧縮成形し、回転円盤法を用いて 37 °C で溶解実験を行った結果をグラフに示した。X 軸、Y 軸、Y 切片として正しいものの組合せはどれか。ただし、 $t = 0$ のとき $C = 0$ とする。



	X 軸	Y 軸	Y 切片
1	t	$\ln(C_s - C)$	$\ln C_s$
2	$\ln(C_s - C)$	t	$\ln C_s$
3	t	C_s	$\ln C_s$
4	t	$C_s - C$	$\ln k$
5	C_s	$\ln(C_s - C)$	$\ln k$

第96回

正解 1

問169 同一粒子径の球形粒子からなる粉体の溶解過程では、粒子が球形を保ちながら溶解し、シンク条件が成り立っているものと仮定すると、Hixon-Crowell の立方根法則

$$\sqrt[3]{w_0} - \sqrt[3]{w_t} = \alpha t$$

が成立する。ここで、 w_0 と w_t は、初期及び一定時間 t 経過後の粒子の質量、 α は比例定数である。

上記の条件を満たす粉末医薬品 1 g の溶解性を調べたところ、試験開始から 2 分後には医薬品の 27.1% が溶解し、 $\alpha = 0.05 (\text{g}^{\frac{1}{3}} \cdot \text{min}^{-1})$ と算出された。試験開始から 6 分後には医薬品の何% が溶解すると予想されるか。最も近い値を選べ。

1 34 2 45 3 56 4 66 5 73 6 81

正解 4

第92回

問 174 薬物の溶解及び製剤からの放出に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 ヒグチ (Higuchi) の式において、放出される薬物の累積値は時間の平方根に比例する。
- 2 ヒクソン・クロケル (Hixson-Crowell) の式は、粒度分布を持つ粉体の溶解現象を表す式である。
- 3 固体分散体中の薬物は、その薬物結晶に比べて溶解速度が小さい。
- 4 安定形の結晶は、準安定形の結晶に比べて溶解速度が大きい。
- 5 無水物は、水和物に比べて水中での溶解速度が大きい。

第97回

正解 1, 5

問 179 グラフは、ある放出制御型製剤についての溶出試験を下に示す条件で実施した結果である。このグラフから推察される製剤的な特徴に関する記述のうち、適切なのはどれか。1つ選べ。ただし、薬物の溶解度は pH によって変化しないものとする。

溶出試験の条件

試験サンプル：

放出制御型製剤 1錠

試験装置：

溶出試験法 第2法

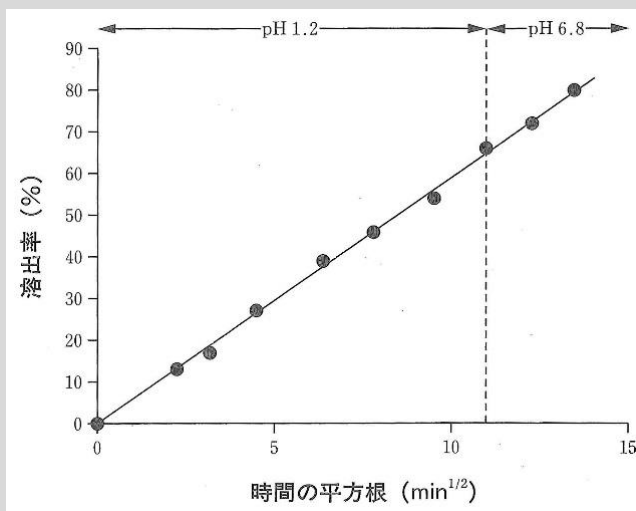
(パドル法)

試験温度：37°C

試験液：

0分～120分 — 溶出試験第1液 (pH 1.2)

120分～180分 — 溶出試験第2液 (pH 6.8)



- 1 腸溶性製剤からの薬物溶出で、pH に依存して溶出量が変わっている。
- 2 不溶性マトリックス型製剤からの薬物溶出で、マトリックス中の拡散が薬物溶出の律速となっている。
- 3 侵食 (エロージョン) 型製剤からの薬物溶出で、水溶性マトリックスの溶解もしくは浸潤に伴って薬物が溶出する。
- 4 リザーバー型製剤からの薬物溶出で、水溶性成分からなる錠剤を被覆している不溶性高分子膜を介して薬物が溶出する。
- 5 浸透圧ポンプ型製剤からの薬物溶出で、錠剤内への水の侵入に伴って薬物が溶出する。

正解 2

第98回

- 問 170 薬物の溶解及び製剤からの放出に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。
- 結晶多形において、安定形の溶解度は準安定形に比べて大きい。
 - 同じ薬物の無水物と水和物を比較した場合、一般に水に対する無水物の溶解度は水和物に比べて大きい。
 - ヒグチ (Higuchi) の式において、放出される薬物量は時間の二乗に比例する。
 - 弱塩基性薬物の溶解度を日本薬局方崩壊試験法における試験液第 1 液と第 2 液で比較すると、一般に第 1 液の方が大きい。

1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d) 4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d)

正解 5

第95回

問 173 固体薬物の溶解速度を回転円盤法で測定し、以下の結果を得た。シンク条件下のみかけの溶解速度定数 ($\text{min}^{-1} \cdot \text{cm}^{-2}$) に最も近い値はどれか。1 つ選べ。

ただし、円盤の有効表面積は 1 cm^2 とし、試験中は変化しないものとする。また、溶液温度は一定であり、薬物の溶解度は 0.5 mg/mL とする。

時間 (min)	0	2	4	6	8	10
溶液の薬物濃度 (mg/mL)	0	0.020	0.040	0.060	0.072	0.080

1 0.010 2 0.014 3 0.016 4 0.018 5 0.020 第91, 98回

正解 5

問 174 $pK_a = 5.2$ の 1 価の弱酸性薬物水溶液に関する記述のうち、正しいのはどれか。1 つ選べ。ただし、イオン形薬物はすべて溶解するものとする。

- pH 5.2 の溶液中では、分子形の薬物のみが存在する。
- pH 7.2 の溶液中では、イオン形薬物分率は約 1% である。
- pH 6.2 における溶解度は、 pH 5.2 と比較して約 10 倍である。
- pH 7.2 における溶解度は、 pH 5.2 と比較して約 50 倍である。
- pH 7.2 における溶解度は、 pH 5.2 と比較して約 100 倍である。

正解 4

第99回

問 50 弱酸性薬物の水溶液の pH が、その薬物の pK_a より 2 高いとき、水溶液中の薬物の分子形 : イオン形の存在比に最も近いのはどれか。1 つ選べ。

分子形 : イオン形

- 1 : 100
- 1 : 10
- 1 : 1
- 10 : 1
- 100 : 1

第98回

正解 1

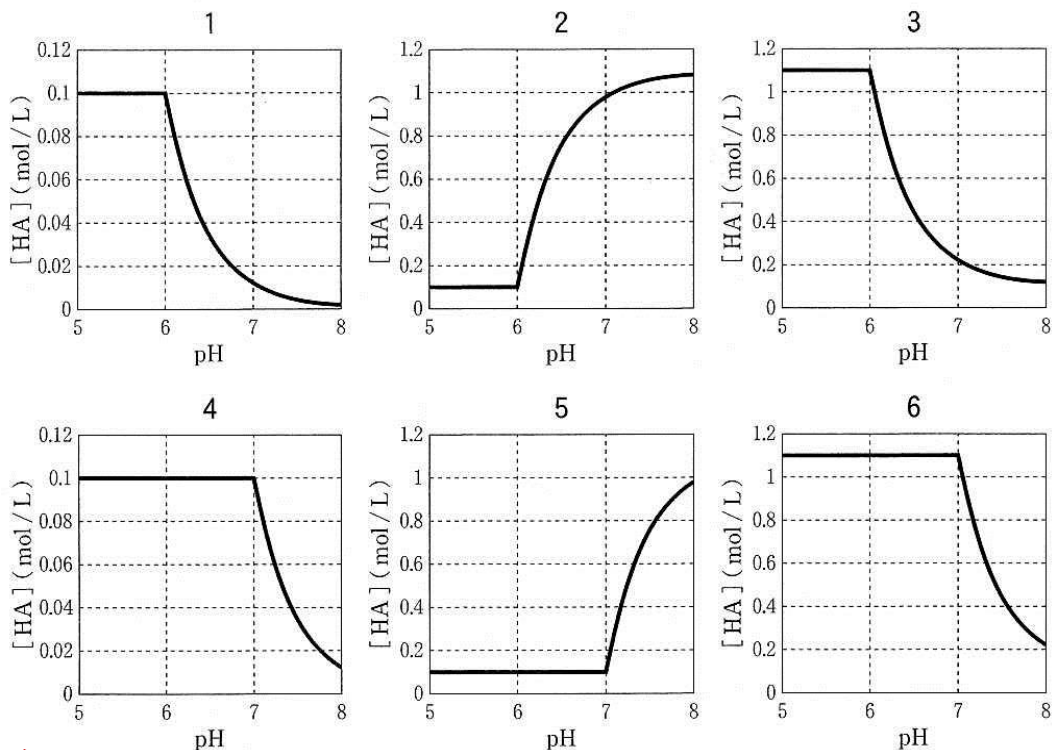
問 41 弱酸性薬物の単純拡散による消化管吸収に及ぼす管腔内 pH の影響として正しい記述はどれか。1つ選べ。ただし、薬物は全て溶解しているものとする。

- 1 pH が低下すると分子形分率が低下し、吸収が増加する。
- 2 pH が低下すると分子形分率が低下し、吸収が減少する。
- 3 pH が低下すると分子形分率が上昇し、吸収が増加する。
- 4 pH が低下すると分子形分率が上昇し、吸収が減少する。
- 5 pH の変化によって、吸収は変化しない。

第100回

正解 3

問169 弱酸性薬物は水溶液中で $HA \rightleftharpoons H^+ + A^-$ のように解離する。pK_a 値が 5.0、非解離形薬物 HA の溶解度が 0.1 mol/L である弱酸性薬物の結晶 0.11 mol を 0.01 mol/L の塩酸 0.1 L に懸濁し、塩基 B を少量ずつ添加していくとき、pH 5 から pH 8 における溶解した非解離形薬物濃度 [HA] を示すグラフは次のどれか。ただし、HA 及び A⁻ は塩酸及び塩基 B と反応せず、結晶の溶解及び塩基 B の添加による体積変化は無視できるものとする。



正解 1

第94回

問 48 Fick の第一法則に従う膜透過において、薬物の透過速度と反比例するのはどれか。
1つ選べ。

- 1 ドナー側（高濃度側）の薬物濃度
- 2 レシーバー側（低濃度側）の薬物濃度
- 3 薬物の拡散係数
- 4 膜の厚さ
- 5 薬物の膜への分配係数

第97回

正解 4

2. 分散系

- ① 界面の性質
- ② 代表的な界面活性剤の種類と性質
- ③ 乳剤の型と性質
- ④ 代表的な分散系とその性質
- ⑤ 分散粒子の沈降現象

問 50 20℃の条件下で、表面張力が最も大きいのはどれか。1つ選べ。

- 1 エタノール
- 2 クロロホルム
- 3 グリセリン
- 4 水
- 5 ベンゼン

第100回

正解 4

問 94 表面・界面張力に関する記述のうち正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 表面・界面張力は表面・界面過剰ギブズ自由エネルギーとして表すことができ、その単位は J/m^2 で表される。
- 2 油滴が水中に存在するとき、サイズが小さい油滴ほどエネルギー的に安定である。
- 3 界面活性剤とは、表面・界面過剰ギブズ自由エネルギーを増大させる化合物の総称である。
- 4 食塩水は、純水に比べて表面張力が大きい。
- 5 ヘキサンは、純水に比べて表面張力が大きい。

第99回

正解 1、4

問 175 界面活性剤の性質に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 ソルビタンモノステアレートの HLB (hydrophile-lipophile balance) 値は、ソルビタンモノラウレートの HLB 値に比べて小さい。
- 2 水溶液の当量伝導度 (モル伝導率) は、ある濃度以上で急激に上昇する。
- 3 アルキル硫酸ナトリウムの直鎖アルキル基 ($\text{C}_{10}\text{H}_{21}\sim\text{C}_{18}\text{H}_{37}$) の炭素数が増加すると、クラフト点は高くなる。
- 4 臨界ミセル濃度以上では、溶液中にミセルとしてのみ存在する。

第97回

正解 1、3

問 52 曇点を有する界面活性剤はどれか。1つ選べ。

- 1 ステアリン酸ナトリウム
- 2 ベンザルコニウム塩化物
- 3 ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル
- 4 レシチン
- 5 ラウリル硫酸ナトリウム

第98回

正解 3

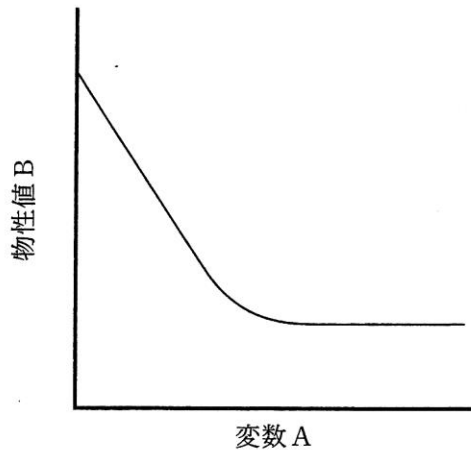
問 174 界面活性剤に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 イオン性界面活性剤において、アルキル鎖が長くなるほどクラフト点は低くなる。
- 2 親水性親油性バランス (HLB) 値が小さい界面活性剤ほど、疎水性が高い。
- 3 HLB 値が 3.7 の界面活性剤 2 g と、HLB 値が 11.5 の界面活性剤 1 g を混合して得た界面活性剤の HLB 値は、7.6 である。
- 4 イオン性界面活性剤水溶液のモル電気伝導率は、臨海ミセル濃度以上で急激に減少する。
- 5 臨界ミセル濃度以上では、界面活性剤分子はミセルを形成するため、単分子として溶解しているものはない。

第100回

正解 2、4

問 171 モノステアリン酸ソルビタン 60 (Span 60) に関する物性値 B を変数 A に対してプロットしたところ、次のグラフが得られた。横軸の変数 A、縦軸の物性値 B、グラフの屈曲点に関連する特性の組合せのうち、正しいものはどれか。



	変数 A	物性値 B	屈曲点に関連する特性
1	水溶液中の Span 60 濃度	溶液の界面張力	臨界ミセル濃度
2	水溶液中の Span 60 濃度	溶液の可溶化能	臨界ミセル濃度
3	温度	Span 60 の水への溶解度	曇点
4	温度	Span 60 の水への溶解度	クラフト点
5	ポリソルベート 80 との混合物における Span 60 の比率 (%)	HLB	o/w 型乳化剤 → w/o 型乳化剤
6	ラウリル硫酸ナトリウムとの混合物における Span 60 の比率 (%)	HLB	o/w 型乳化剤 → w/o 型乳化剤

正解 1

第93回

問169 界面活性剤に関する記述と、構造式イ、ロ、ハで示される界面活性剤の正しい組合せはどれか。

- a 殺菌・消毒剤として用いられる。
- b ある温度以上で水への溶解度が急激に上昇する。
- c ある温度以上で水への溶解度が急激に低下する。

- イ $\text{CH}_3(\text{CH}_2)_{11}\text{SO}_3\text{Na}$
- ロ $[\text{C}_6\text{H}_5\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2\text{C}_{12}\text{H}_{25}]\text{Cl}$
- ハ $\text{CH}_3(\text{CH}_2)_{11}\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_9\text{H}$

	a	b	c
1	イ	ロ	ハ
2	イ	ハ	ロ
3	ロ	イ	ハ
4	ロ	ハ	イ
5	ハ	イ	ロ
6	ハ	ロ	イ

第96回

正解 3

問170 界面活性剤に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a イオン性界面活性剤水溶液では、クラフト点以上になるとミセルが形成されない。
- b 非イオン性界面活性剤水溶液では、曇点以上になると2相分離が起こり、溶液は白濁する。
- c Hydrophile-Lipophile Balance (HLB) が大きい界面活性剤ほど親油性である。
- d ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステルは、非イオン性界面活性剤に分類される。

- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d)
- 4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d) 第91回

正解 5

問 175 界面活性剤に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 ラウリル硫酸ナトリウムは、液体表面に吸着されにくく、負吸着を示す。
- 2 界面活性剤水溶液の表面張力は、臨界ミセル濃度以上で急激に低下する。
- 3 イオン性界面活性剤の水への溶解度は、クラフト点以上で急激に上昇する。
- 4 非イオン性界面活性剤の水への溶解度は、曇点以上で急激に低下する。
- 5 HLB (hydrophile-lipophile balance) 値が 5 未満の界面活性剤は、水に極めて溶けやすい。

第99回

正解 3、4

問171 界面活性剤の性質に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a ソルビタンモノラウレートの HLB(hydrophile-lipophile balance) 値は、ソルビタンモノステアレートの HLB 値に比べて小さい。
- b アルキル硫酸ナトリウムの直鎖アルキル基 ($C_{10}H_{21} \sim C_{18}H_{37}$) の炭素数が増加すると、クラフト点は低くなる。
- c ドデシル硫酸ナトリウム水溶液の当量電気伝導度は、ある濃度以上で急激に低下する。
- d ポリオキシエチレン α -ノニルフェニルエーテルのオキシエチレン基の付加モル数が増加すると、臨界ミセル濃度は高くなる。

- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d)
4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d) 第94回

正解 6

問 2 コロイド粒子の物性と最も関連性のない現象はどれか。1つ選べ。

- 1 チンダル現象 2 ブラウン運動 3 塩析
4 コンプトン散乱 5 電気二重層の形成 第98回

正解 4

問 48 コロイド分散系はどれか。1つ選べ。

- 1 赤血球浮遊液 2 懸濁性点眼液 3 5%ブドウ糖液
4 生理食塩液 5 5% ポリソルベート 80 水溶液 第99回

正解 5

問 171 コロイドに関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a. 親水コロイド溶液にエチルアルコールを添加すると、コロイドに富む相と希薄な相に分離するコアセルベーションが起こる。
- b. コロイド溶液に光をあてると、コロイド粒子が光を散乱するブラウン運動が起こる。
- c. コロイド粒子は分散媒分子の衝突を受けて、不規則な運動をするチンダル現象を示す。
- d. 分散粒子が荷電していると、対イオンが分散粒子のまわりに引き寄せられ、粒子と分散媒の界面近傍で電気二重層を形成する。

- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d) 第95回
4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d)

正解 3

問170 エマルションの乳化型の判定に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a スダンⅢを少量添加してエマルション全体が着色すると o/w 型である。
- b エマルションの電気抵抗は o/w 型の方が w/o 型に比べて小さい。
- c 水で希釈して容易に混ざり合うと w/o 型である。
- d エマルションに水を加えると粘度が低下し、油を加えると粘度が上昇するときは o/w 型である。

	a	b	c	d
1	正	正	誤	誤
2	誤	正	誤	正
3	誤	誤	正	誤
4	正	誤	正	正
5	誤	正	誤	誤

第92回

正解 2

問 49 o/w 型エマルションの性質として、正しいのはどれか。1 つ選べ。

- 1 水に滴下したとき、水表面で容易に広がる。
- 2 スダンⅢを少量添加すると全体が着色される。
- 3 w/o 型エマルションよりも電気伝導度が小さい。
- 4 半透膜を透過する。
- 5 水を加えると粘度が増加する。

第97回

正解 1

問 174 乳剤に関する記述のうち、正しいのはどれか。2 つ選べ。

- 1 o/w 型の乳剤は、電気伝導性を示さない。
- 2 合一しても振とうすればもとの分散状態に戻る。
- 3 w/o/w 型や o/w/o 型などの多重乳剤がある。
- 4 分散媒と分散相の密度差を小さくすると、乳剤の分散状態は安定化する。
- 5 w/o 型の乳剤は、メチレンブルーを加えると全体が着色される。

第98 回

正解 3、4

問172 分散系の安定性に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a 液中に分散したコロイド粒子は、Stokes の式に従って沈降する。
- b 親水性コロイドは、溶液の電解質濃度を高めることによって安定化できる。
- c 乳剤のクリーム分離は、内相すべてが完全に合一することによって起こる。
- d ケーキングを起こしやすい懸濁剤は、分散媒の粘度を増大させることによって安定化できる。

	a	b	c	d
1	正	誤	正	正
2	誤	正	正	誤
3	正	正	正	誤
4	正	誤	誤	正
5	誤	誤	誤	正

第94 回

正解 5

問 172 乳剤を放置したときに起こりうる状態変化を表す語句として、正しいものの組合せはどれか。

- a. クリーミング
- b. ケーキング
- c. ゼル化
- d. 塩析
- e. 合一

1 (a、b) 2 (a、e) 3 (b、c) 4 (c、d) 5 (d、e)

第95回

正解 2

3. 製剤材料の物性

- ① 流動と変形(レオロジー)の概念、代表的なモデル
- ② 高分子の構造と高分子溶液の性質
- ③ 製剤分野で汎用される高分子の物性
- ④ 粉体の性質
- ⑤ 製剤材料としての分子集合体
- ⑥ 薬物と製剤材料の安定性に影響する要因、安定化方法
- ⑦ 粉末X線回折測定法の原理と利用法
- ⑧ 製剤材料の物性の測定

問171 レオロジーに関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a ニュートン流動では、粘度はせん断速度の増加に比例して増加する。
- b 塑性流動には降伏値があり、この値より大きなせん断応力ではせん断速度に無関係に粘度は一定の値である。
- c ダイラタント流動では、粘度はせん断速度の増加とともに減少する。
- d チキソトロピーを示すものでは、流動曲線(レオグラム)の上昇曲線と下降曲線は同一とはならない。

- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d)
 4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d) 第91回

正解 5

問172 粘度に関する記述の ~ 内に入れるべき語句の正しい組合せはどれか。

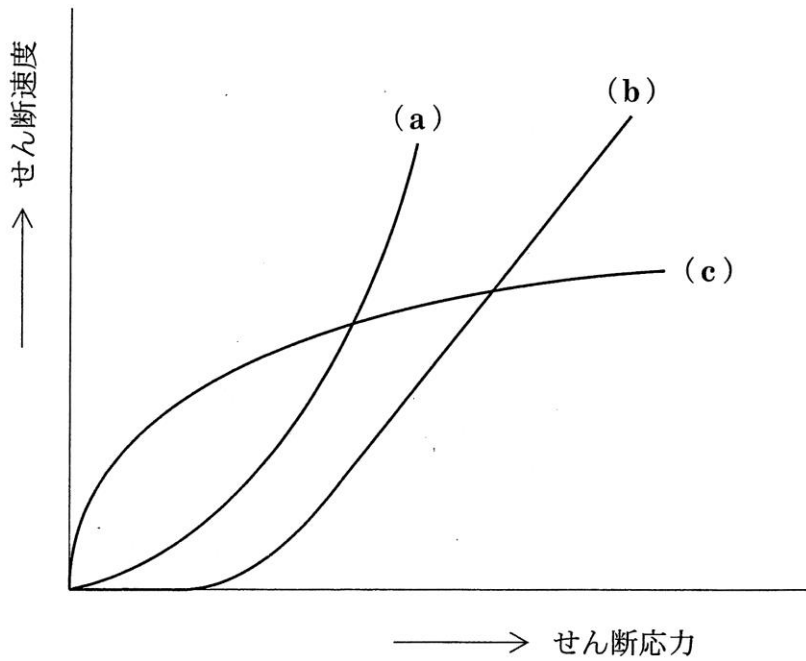
ニュートン流体について、せん断応力を横軸に、せん断速度を縦軸にプロットすると直線が得られ、その傾きの逆数は粘性係数あるいは と呼ばれる。 を同温度のその液体の密度で除した値を という。 の単位として、 が用いられる。

	a	b	c
1	粘 度	動粘度	$m^2 \cdot s^{-1}$
2	粘 度	極限粘度	$dL \cdot g^{-1}$
3	極限粘度	動粘度	$Pa \cdot s$
4	極限粘度	粘 度	$m^2 \cdot s^{-1}$
5	動粘度	極限粘度	$Pa \cdot s$
6	動粘度	粘 度	$dL \cdot g^{-1}$

正解 1

第93回

問171 次の図は物質のせん断速度とせん断応力の関係を示したものである。それぞれのレオグラムを示す物質として、正しい組合せはどれか。



	(a)	(b)	(c)
1	でんぷんの60% 水性懸濁液	チンク油	メチルセルロースの 1.0% 水溶液
2	チンク油	でんぷんの60% 水性懸濁液	メチルセルロースの 1.0% 水溶液
3	チンク油	メチルセルロースの 1.0% 水溶液	でんぷんの60% 水性懸濁液
4	メチルセルロースの 1.0% 水溶液	チンク油	でんぷんの60% 水性懸濁液
5	でんぷんの60% 水性懸濁液	メチルセルロースの 1.0% 水溶液	チンク油
6	メチルセルロースの 1.0% 水溶液	でんぷんの60% 水性懸濁液	チンク油

正解 4

第83, 92回

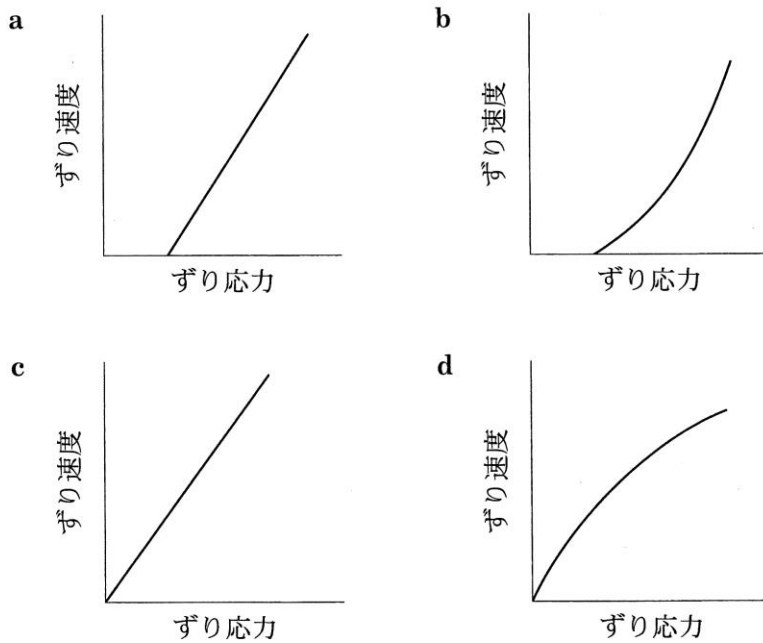
問 49 懸濁性注射剤にせん断応力を与えて、等温下で静置するとき、粘度が徐々に回復する現象を何というか。1つ選べ。

- 1 ニュートン流動 2 塑性流動 3 クリーミング
4 ダイラタンシー 5 チキソトロピー

第99回

正解 5

問170 図 a ~ d は流体のレオグラムを示す。各レオグラムとそれを示す流体の対応のうち、正しいものはどれか。



	a	b	c	d
1	チンク油	3% アルギン酸 ナトリウム水溶液	グリセリン	60% デンプン 水性懸濁液
2	3% アルギン酸 ナトリウム水溶液	グリセリン	60% デンプン 水性懸濁液	チンク油
3	グリセリン	3% アルギン酸 ナトリウム水溶液	チンク油	60% デンプン 水性懸濁液
4	グリセリン	チンク油	60% デンプン 水性懸濁液	3% アルギン酸 ナトリウム水溶液
5	60% デンプン 水性懸濁液	チンク油	グリセリン	3% アルギン酸 ナトリウム水溶液

正解 1

第96回

問 52 ニュートン流体のせん断速度を縦軸に、せん断応力を横軸になるよう図を作成した。得られた図に関する記述のうち、正しいのはどれか。1つ選べ。

- 1 粘定か大きいほど、直線の傾きは大きくなる。
- 2 縦軸との切片は降伏値を表す。
- 3 曲線はチキソトロピーを表す。
- 4 原点を通り、下に凸の曲線となる。
- 5 原点を通る直線となる。

第100回

正解 5

問173 レオロジーに関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

	a	b	c	d
a 粘弾性体に一定の応力を加え続けたとき、生じるひずみが時間経過とともに増大する現象をクリープという。	1 誤	正	誤	正
b 粘弾性体のフォークト(Voigt)モデルは、バネとダッシュポットを直列に組合せたモデルである。	2 誤	正	正	誤
c アンドレード(Andrade)の式は、液体の粘度と絶対温度の関係を表す。	3 正	誤	誤	正
d オストワルド(Ostwald)型粘度計は、非ニュートン流体の粘度測定に適している。	4 正	誤	正	誤
	5 正	誤	正	正

第94回

正解4

問175 高分子及びその溶液に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 鎖状高分子は、良溶媒中で収縮してコイル形状となる。
 - 2 マクロゴール 20000 (分子量 20,000 のポリエチレングリコール) は、室温で水に不溶である。
 - 3 毛細管粘度計は、非ニュートン流体の粘度測定に適する。
 - 4 高分子溶液の極限粘度から、高分子の平均分子量を求めることができる。
 - 5 Voigt の力学的モデルでは、応力一定のとき、ひずみは時間と共に増大し、一定の値に収束する。
- 第100回

正解4、5

問177 高分子材料に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 ゼラチン水溶液に貧溶媒のエタノールを加え続けると、ゼラチンの高濃度相(コアセルベート)が分離する。
- 2 ヒアルロン酸ナトリウムは、優れた保水性を有する天然高分子である。
- 3 マクロゴール 6000 は、常温で液体である。
- 4 セラセフェートは、pH2 付近で溶解する胃溶性高分子である。
- 5 カルメロースカルシウムは、水に容易に溶解し、増粘剤として用いられる。

正解1, 2

第99回

問166 医薬品の懸濁剤を調製したところ、粒子が速やかに沈降して使用しにくかった。そこで、沈降速度を調整するため、医薬品粉末の粒子径を1/4の大きさとし、分散媒を粘度が1.5倍で密度が同一の液体に変更した。このとき、沈降に要する時間はもとの何倍になるか。最も近い数値を選べ。ただし、医薬品は同一粒子径の球形粒子からなり、分散媒には溶解しない。また、粒子の沈降過程はストークスの式に従うものとする。

- 1 4 2 6 3 9 4 16 5 24 6 36

正解 5

第92回

問 50 沈降法によって粒子径を求めるときに用いる式はどれか。1つ選べ。

- 1 コゼニーカーマン式 2 ラングミュアー式 3 BET式
4 ストークス式 5 ブラッグ式

第97回

正解 4

問 3 懸濁液における粒子の沈降速度と比例関係にあるものはどれか。1つ選べ。ただし、粒子は球状であり、ストークスの法則が成り立つものとする。

- 1 分散媒の密度 2 粒子の密度 3 分散媒の粘度
4 粒子の半径 5 粒子の半径の2乗

第99回

正解 5

問167 [I]欄に粉体の粒子径測定方法の名称、[II]欄にその説明、[III]欄に得られる情報を示す。正しいものの組合せはどれか。

	[I]欄	[II]欄	[III]欄
a	コールターカウンタ法	レーザー光を照射して生じる散乱光を解析して求める。	体積基準の粒子径分布
b	沈降法	粒子が液体中を沈降する速度より求める。	質量基準の粒子径分布
c	ふるい分け法	ふるいを用いて分級して求める。	質量基準の粒子径分布
d	空気透過法	Kozeny-Carman の式から求めた粉体の比表面積より算出する。	体積基準の粒子径分布
e	ガス吸着法	BET の式から求めた粉体の比表面積より算出する。	面積基準の粒子径分布

1 (a、b)

2 (a、e)

3 (b、c)

4 (c、d)

5 (d、e)

第96回

正解 3

問166 粉体の粒子径あるいは粒子径分布に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

a 顕微鏡法では、個数基準の粒子径分布が得られる。

b 沈降法では、質量基準の粒子径分布が得られる。

c 同一粉体では、個数基準分布から得られるモード径は、質量基準分布から得られるモード径よりも大きい。

d 同一粉体では、体積平均径は、面積平均径よりも小さい。

e マーチン径は、粒子の投影面積と同じ面積を持つ円の直径で表したものである。

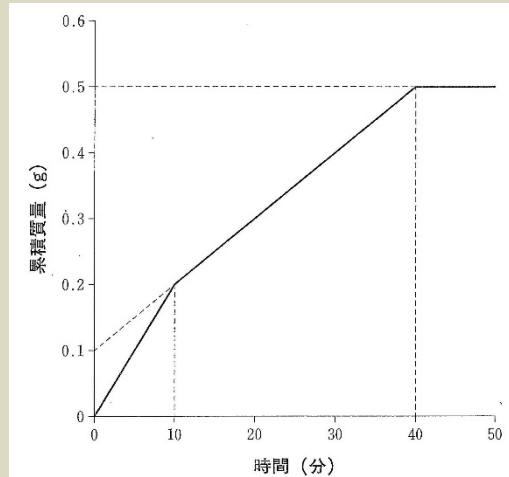
	a	b	c	d	e
1	誤	正	正	正	誤
2	正	正	誤	正	正
3	誤	誤	正	正	正
4	正	正	誤	誤	誤
5	正	誤	誤	誤	正

第91回

正解 4

問 176 大小 2 種類の粒子径を有する同一物質の混合粒子の質量を、分散沈降法により沈降天秤を用いて測定したところ、図に示す結果を得た。以下の記述のうち、正しいのはどれか。2 つ選べ。ただし、粒子の沈降はストークスの式に従うものとする。

- 1 大粒子と小粒子の粒子径比は 2:1 である。
- 2 大粒子と小粒子の粒子径比は 4:1 である。
- 3 大粒子と小粒子の質量比は 1:2 である。
- 4 大粒子と小粒子の質量比は 2:3 である。
- 5 大粒子と小粒子の質量比は 1:4 である。



正解 1, 5

第99回

問167 粉体の粒度分布、比表面積に関する次の記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a Langmuir 式や BET 式を用いるガス吸着法は、いずれも試料粉体表面におけるガスの単分子層吸着量を算出し、比表面積を求める方法である。
- b マーチン径は、粒子の投影面積と同じ面積を持つ円の直径に相当する。
- c メジアン径は、質量基準及び個数基準の累積分布曲線における 50 % 累積値に対応する粒子径である。
- d 粉体の粒度分布は、一般に正規分布になる。

- | | | |
|----------|----------|----------|
| 1 (a, b) | 2 (a, c) | 3 (a, d) |
| 4 (b, c) | 5 (b, d) | 6 (c, d) |

第93回

正解 2

問 176 粉体の性質に関する記述のうち、正しいのはどれか。2 つ選べ。

- 1 粉砕しても、その比表面積は変化しない。
- 2 粉砕すると、安息角は小さくなる。
- 3 粒子径が大きいほど、空隙率が大きい粉体層を形成する。
- 4 個数平均径 D_n と質量平均径 D_w を比較すると、 $D_n < D_w$ である。
- 5 ガス吸着法や空気透過法による粒子径測定では、粒度分布は得られない。

正解 4, 5

第97回

問168 粉体の性質及びその評価法に関する記述のうち、正しいものはどれか。

- 1 一般に、粉体のかさ密度は粒子密度に比べて大きい。
- 2 粉体層のみかけ体積に対する粒子の実体積の割合を充てん率といい、充てん率の逆数を粉体の空隙率という。
- 3 密度が同一な球形粒子からなる粉体では、それぞれの粉体の平均粒子径は比表面積に反比例する。
- 4 コールターカウンター法では、個々の粒子の粒子径と同時に粒子形状の情報が得られる。
- 5 レーザー回折法は粉体の粒子径の測定法の1つであり、粉体の結晶性も評価できる。

第94回

正解 3

問 168 粒子及び粉体に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a. 粉体の内部摩擦係数と付着力が小さいほど、流動性はよい。
- b. 沈降法による粒度分布測定では、質量基準の粒度分布が得られる。
- c. エルダー (Elder) の仮説が成立する場合、2種類以上の水溶性粉体の混合物の臨界相対湿度 (CRH) は、個々の粉体の CRH よりも大きくなる。
- d. 粉体を圧縮して製した平面に液を滴下した場合、拡張ぬれの接触角は付着ぬれの接触角よりも大きい。

1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d)

正解 1 4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d)

第95回

問 169 真密度 1.6 g/cm^3 で、空隙率 0.20 の特性をもつ粉体がある。いまこれを 1 kg 秤量し、容器に移し替えたい。粉体のみかけ体積の 20%増を容器の容積として見込むとすると、必要最低限の内容積 (cm^3) として最も適当な値はどれか。ただし、容器内での充てん状態は、空隙率測定時の状態と同じとする。

正解 2 1 630 2 940 3 1,600 4 2,000 5 2,400 第95回

問 176 真密度が 1.2 g/cm^3 の粉体を 500 mL の容器にすり切り充てんしたところ、粉体層の空隙率は 20%であった。この容器をタッピングしたところ、粉体層の空隙率は 17%となった。タッピング後の粉体層のかさ密度 (g/cm^3) に最も近い値はどれか。1つ選べ。

1 0.7 2 0.8 3 0.9 4 1.0 5 1.1 第100回

正解 4

問 51 粉体の流動性を表す指標として最も適切なのはどれか。1つ選べ。

- 1 真密度 2 安息角 3 比表面積 4 形状係数 5 接触角

正解 2

第100回

問167 一定量の粉体試料を底面積 3 cm^2 の円筒容器に静かに充てんしたところ、高さは 10 cm となり、その空隙率は 55% であった。次にその粉体の入った容器を一定の高さから一定速度で繰り返し落下させてタップ充てんしたところ、粉体層の高さは 7 cm となった。このときの空隙率(%)として最も近い値はどれか。

- 1 33 2 36 3 39 4 42 5 45

第91回

正解 2

問168 空隙率が 65% の粉体層がある。空隙率が 20% になるまで粉体を圧縮したとき、粉体層の見かけ密度(かさ密度)はもとの状態の何倍になるか、最も近い数値はどれか。ただし、粉体粒子の真密度は 1.65 g/cm^3 であり、粒子内に空隙はなく、圧縮により真密度は変化しないものとする。

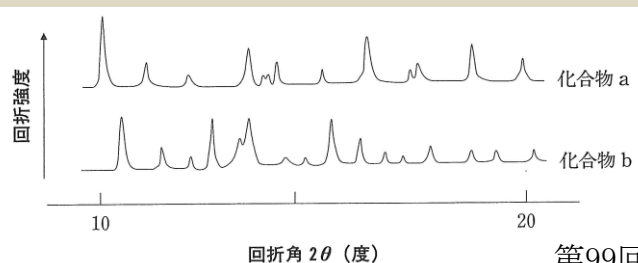
- 1 1.9 2 2.3 3 2.6
4 2.9 5 3.3 6 3.6

第93回

正解 2

問 54 同一化学組成の化合物 a と b の粉末 X 線回折パターンが下図のようになった。この図から推定される化合物 a と b の関係はどれか。1つ選べ。

- 1 同一の結晶形である。
2 非晶質と結晶である。
3 結晶多形である。
4 粒子径が異なる。
5 真密度が等しい。



第99回

正解 3

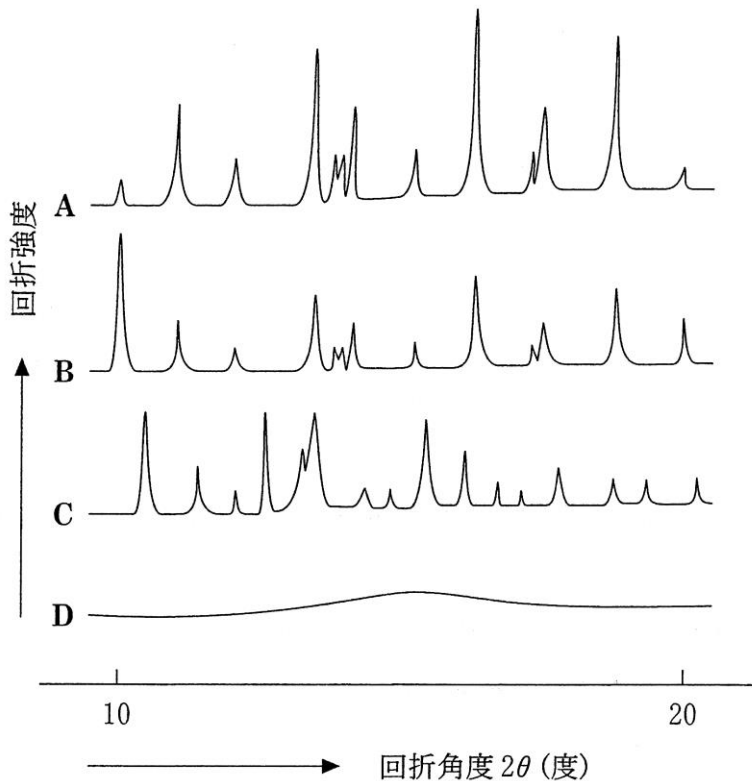
問 175 薬物の物性に関する記述のうち、正しいのほどどれか。1つ選べ。

- 1 非晶質は、熱力学的に平衡状態にある。
2 共融混合物では、異なる成分どうしが結晶格子を形成している。
3 水和物結晶は、その無水物結晶よりも水に対する溶解度が高い。
4 固溶体中において、薬物は結晶状態で分散している。
5 結晶多形において、準安定形に比べて安定形の方が融点が高い。

第98回

正解 5

問167 ある薬物の固体Aに粉碎や再結晶などの処理を加えたところ、下記の粉末X線回折パターンを与える固体B～Dが得られた。次の記述について正しいものの組合せはどれか。ただし、これらの処理により、化学的変化は起こらず、また固体の組成に変化はないものとする。



- a 固体Aと固体Bでは結晶の単位格子の大きさが異なる。
- b 固体Cは固体Aの結晶多形である。
- c 固体Bと固体Cの結晶構造は同じであるが、結晶の外観が異なる。
- d 固体D内の分子の配列に規則性がない。

- | | | |
|---------|---------|---------|
| 1 (a、b) | 2 (a、c) | 3 (a、d) |
| 4 (b、c) | 5 (b、d) | 6 (c、d) |

第92回

正解 5

問 53 薬物の結晶多形を検出できる方法はどれか。1つ選べ。

- | | | |
|---------|---------|--------|
| 1 空気透過法 | 2 X線回折法 | 3 旋光度法 |
| 4 粘度測定法 | 5 気体吸着法 | |

第98回

正解 2

問 173 薬物の溶解及び放出に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 結晶多形間で異なる溶解速度を示すのは、各々の固相における化学ポテンシャルが異なるためである。
- 2 Higuchi 式において、単位面積当たりの累積薬物放出量の平方根は、時間に比例する。
- 3 球体である薬物粒子が、形状を保持したまま縮小しながら溶出する時の溶解速度定数は、Hixson-Crowell 式を用いて算出できる。
- 4 回転円盤法により、固体薬物の表面積を経時的に変化させて溶解実験を行い、Gibb 式を用いることで薬物の溶解速度定数を算出できる。

正解 1, 3

第100回

4. 代表的な製剤

- ① 代表的な剤形の種類と特徴
- ② 代表的な固形製剤の種類と性質
- ③ 代表的な半固形製剤の種類と性質
- ④ 代表的な液状製剤の種類と性質
- ⑤ 代表的な無菌製剤の種類と性質
- ⑥ エアゾール剤とその類似製剤
- ⑦ 代表的な製剤添加物の種類と性質
- ⑧ 代表的な製剤の有効性と安全性評価法

問 51 日本薬局方製剤総則で、口腔内に適用する製剤に分類されるのはどれか。1つ選べ。

- 1 分散錠 2 チュアブル錠 3 口腔内崩壊錠
4 付着錠 5 発泡錠

第98回

正解 4

問 50 製剤総則において、粒状に造粒した経口投与する製剤と規定されているのはどれか。1つ選べ。

- 1 発泡錠 2 散剤 3 顆粒剤 4 分散錠 5 懸濁剤

正解 3

第99回

問 51 直接打錠用の結合剤はどれか。1つ選べ。

- 1 結晶セルロース
2 ヒプロメロース
3 ショ糖
4 ポビドン
5 ヒプロメロースフタル酸エステル

第97回

正解 1

問 54 以下の添加剤のうち、崩壊剤として用いられるのはどれか。1つ選べ。

- 1 カルメロースカルシウム 2 ヒプロメロースフタル酸エステル
3 乳酸・グリコール酸共重合体 3 エチルセルロース
4 ステアリン酸マグネシウム

第100回

正解 1

問170 固形製剤の物性評価に関する記述とそれを説明するための式の対応として、正しいものの組合せはどれか。

	固形製剤の物性評価に関する記述	式
a	接触角が小さいほど固体の表面はぬれやすい。	Young の式
b	粘度が低い溶媒ほど錠剤中への浸入速度が大きい。	Washburn の式
c	溶解過程では、かく拌条件により溶解速度が変化する。	Higuchi の式
d	粉体層に空気を透過させ、透過速度と圧力低下の関係から粉体の比表面積を測定する。	Langmuir の式

- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d)
 4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d) 第94回

正解 1

問173 カプセル剤に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a 硬カプセルの充てん方式には disc 式、compress 式、Auger 式などがある。
- b ロータリーダイス法は、二重ノズルの内側と外側から薬液と被膜液を吐出して軟カプセルを製造する方法である。
- c 5号カプセルの容量は、1号カプセルの容量より大きい。
- d スパンスル型カプセルは、速放出性顆粒と種々の徐放出性顆粒を混合してカプセルに充てんしたものである。

	a	b	c	d
1	正	正	誤	誤
2	誤	誤	正	正
3	正	誤	誤	正
4	誤	正	誤	正
5	正	正	正	誤

第91回

正解 3

問 278-279 入院中の 5 歳女児。体重 21 kg。39.0°C の発熱が認められたので、アセトアミノフェン坐剤 200 mg が投薬されることになった。

問 279(薬剤) 本坐剤の基剤には、半合成油脂性基剤であるハードファット(ウイテプゾール)が用いられている。ハードファットに関する記述のうち、正しいのはどれか。1つ選べ。

- 1 直腸内の水分により速やかに溶解し、主薬を放出する。
- 2 冷所保存しではない。
- 3 飽和脂肪酸のモノ、ジ、トリグリセリドの混合物である。
- 4 坐剤の成形にプラスチック製容器は使用できない。
- 5 結晶多形が存在する。

正解 3

(第 100 回)

問 310-311 薬剤師が医師に同行して、糖尿病治療中の在宅患者を訪問した際、患者の家族よりおしりが赤くなっていると訴えがあった。医師が診察したところ、尾骨部周辺から多くの漆出液がでていた。薬剤師は、医師から「褥瘡になっている。まず、外用剤に滲出液を吸収させたい。適切な薬剤はないか。」と相談された。

問 310 (実務) 以下の製剤のうち、薬剤師が提案するものとして、最も適切なのはどれか。1つ選べ。

- 1 白色ワセリン
- 2 親水クリーム (親水軟膏)
- 3 マクロゴール軟膏
- 4 単軟膏
- 5 吸水軟膏

正解 3

(第 100 回)

問174 軟膏基剤に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 創傷面に水分を補給したいときには、水溶性基剤を用いる。
- b 吸水軟膏は、水相を含む乳剤性基剤である。
- c 乳剤性基剤は、皮膚刺激性が少なく、びらんへの使用に適している。
- d w/o 型の乳剤性基剤と水溶性基剤との混合は、避けるべきである。

- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d)
- 4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d)

正解 5

第94回

問174 坐剤に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a カカオ脂(79%) + レシチン(1%) + 水(20%)からなる基剤は、o/w 型乳剤性基剤に分類される。
- b 直腸上部から吸収される薬物は、肝初回通過効果を受けにくい。
- c マクロゴール基剤からの薬物の放出は、主に分泌液中への基剤の溶解に依存する。
- d 別に規定するもののほか、製剤均一性試験法に適合する。
- e 密閉あるいは気密容器に入れて保存する。

	a	b	c	d	e
1	誤	正	正	誤	誤
2	正	正	誤	正	誤
3	誤	正	誤	誤	正
4	誤	誤	正	正	誤
5	正	誤	正	正	正

正解 5

第95回

問 54 水中油型の乳剤性基剤はどれか。1つ選べ。

- 1 マクロゴール 2 白色ワセリン 3 精製ラノリン
4 流動パラフィン 5 親水クリーム

第98回

正解 5

問173 軟膏基剤に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

	a	b	c	d	e
a 白色ワセリンは、疎水性であり、刺激性が少ない。	1 正	正	誤	誤	誤
b プラスチベースは、流動パラフィンからなり、温度変化により稠度があまり変動しないことや刺激性がないことが特徴である。	2 正	正	誤	誤	正
c 乳剤性基剤は、分泌物が多いときであっても適用部位の症状を悪化させることはない。	3 誤	誤	誤	正	誤
d 親水ワセリンは、水相を有する乳剤性基剤である。	4 正	誤	正	正	正
e マクロゴール軟膏では、重合度が異なる各種のマクロゴールを組み合わせて目的に応じた稠度の軟膏基剤をつくることができる。	5 誤	誤	正	正	正

第92回

正解 2

問 278-279 医薬品として未承認のヒドロキノンの軟膏剤を院内製剤として調製してほしいと、皮膚科の医師から薬剤部に依頼があった。

問 278 (実務) この製剤に関する記述のうち、誤っているのはどれか。1つ選べ。

- 1 病院内の審査委員会で承認を得て調製し、使用した。
- 2 使用する患者からインフォームド・コンセントを得た。
- 3 調製した病院の患者のみに使用できる。
- 4 効果及び副作用の監視、評価を行った。
- 5 副作用が生じたとき、医薬品副作用被害救済制度の対象となる。

正解 5

問 279 (薬剤) 薬剤部で油脂性基剤を用いて調製することになった。基剤として、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 バニシングクリーム
- 2 コールドクリーム
- 3 マクロゴール軟膏
- 4 プラスチペース
- 5 白色ワセリン

第97回

正解 4、5

問 177 無菌製剤に関する記述のうち、正しいのはどれか。1つ選べ。

- 1 懸濁性点眼剤中の粒子は、通例、最大粒子径 $75\ \mu\text{m}$ 以下である。
- 2 注射剤の溶剤として、有機溶剤を用いることはできない。
- 3 点眼剤の添加剤として、ホウ酸を用いることはできない。
- 4 懸濁性注射剤は、静脈内に投与できる。
- 5 乳濁性注射剤は、脊髄腔内に投与できる。

第97回

正解 1

問175 無菌製剤に用いられる添加剤に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a 濃グリセリンは、インスリン注射液の等張化剤として使用される。
- b メチルセルロースは、点眼剤の粘稠剤として使用される。
- c パラオキシ安息香酸エステル類は、リンゲル液の保存剤として使用される。
- d クロロブタノールは、注射剤の保存剤としてだけでなく、無痛化剤としても使用される。

	a	b	c	d
1	正	正	誤	正
2	誤	正	正	誤
3	誤	誤	正	誤
4	正	誤	正	正
5	誤	正	誤	誤

第96回

正解 1

問174 無菌製剤の製剤添加剤に関する記述のうち、正しいものはどれか。

- 1 日本薬局方インスリン注射液には、等張化剤として塩化ナトリウムが添加されている。
- 2 用時溶解して用いる注射剤には、賦形のみを目的とする添加剤を加えてはならない。
- 3 ブドウ糖輸液製剤には、通例保存剤を添加する。
- 4 点眼剤には、pH を調整する目的で無害の酸又はアルカリを加えてはならない。
- 5 塩化ベンザルコニウムは、点眼剤用保存剤としても用いられる。

第91回

正解 5

問 177 注射剤の溶剤に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 通例、生理食塩液及びリンゲル液は、注射用水の代用として用いることができる。
- 2 皮内、皮下及び筋肉内投与のみに用いる水性溶剤は、エンドトキシン試験法の適用を受ける。
- 3 エタノールやプロピレングリコールは、非水性注射剤の溶剤として用いることができる。
- 4 鉱油試験に適合する流動パラフィンは、非水性注射剤の溶剤として用いることができる。
- 5 溶剤に注射用水を用いた場合は、添付する文書、容器もしくは被包に、溶剤が注射用水であることを記載する必要がある。

第100回

正解 1、3

問 274 (薬剤) テオフィリンの溶解度を上昇させる目的で、アミノフィリン注射液に含有されている添加剤はどれか。1つ選べ。

- 1 エチレンジアミン
- 2 ポリエチレングリコール
- 3 β -シクロデキストリン
- 4 ドデシル硫酸ナトリウム
- 5 ベンジルアルコール

第99回

正解 1

問 176 日本薬局方製剤総則の目に投与する製剤に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 点眼剤の非水性溶剤として、植物油を用いることはできない。
- 2 点眼剤及び眼軟膏剤の容器として、通例、気密容器を用いる。
- 3 点眼剤は、発熱性物質試験法に適合しなければならない。
- 4 懸濁性点眼剤中の粒子は、通例、最大粒子径 $75 \mu\text{m}$ 以下である。
- 5 眼軟膏剤には、保存剤を加えることができない。

第98回

正解 2、4

問 52 無菌製剤と規定されているのはどれか。1つ選べ。

- 1 含嗽剤
- 2 吸入液剤
- 3 注腸剤
- 4 眼軟膏剤
- 5 軟膏剤

正解 4

第99回

問176 医薬品添加剤に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a ヒプロメロースフタル酸エステルは、錠剤の腸溶性コーティング剤として用いられる。
- b メチレンブルーは、点眼剤の着色を目的に用いられる。
- c 用時溶解して用いる注射剤に賦形剤を加えることはできない。
- d パラオキシ安息香酸エステル類は、軟膏剤の保存剤として用いられる。

1 (a、b)

2 (a、c)

3 (a、d)

4 (b、c)

5 (b、d)

6 (c、d)

第95回

正解3

問 282-283 在宅患者訪問薬剤管理指導の際、息者の家族よりアスピリン腸溶錠 100 mg を嚥下しにくいので粉碎して飲ませても良いかとの質問があった。

問 282 (実務) 回答内容として、最も適切なのはどれか。1つ選べ。

- 1 家族が粉碎して服用させてください。
- 2 薬局に戻り粉碎し分包したものをお届けします。
- 3 粉碎せずにぬるま湯に溶かして服用させてください。
- 4 医師に処方変更を依頼します。
- 5 服用できないことを次回の診察時に医師に相談してください。

正解4

問 283 (薬剤) この錠剤には以下の5つの添加剤が含まれる。腸溶性コーティング剤として使用されているのはどれか。1つ選べ。

- 1 カルメロース
- 2 トウモロコシデンプン
- 3 メタクリル酸コポリマー
- 4 マクロゴール 6000
- 5 タルク

第97回

正解3

問177 医薬品添加剤に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a インスリン注射液には、フェノール又はクレゾールが保存剤として加えられている。
 - b ヒドロキシプロピルセルロースは結合剤として、低置換度ヒドロキシプロピルセルロースは崩壊剤として用いられる。
 - c カルメロースカルシウムは、滑沢剤として用いられる。
 - d ヒプロメロースは、腸溶性コーティング剤として用いられる。
- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d)
 4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d)

第93回

正解 1

問169 [I]欄の薬物に対する溶解補助剤を[II]欄、その可溶化の機構を[III]欄に示す。正しいものの組合せはどれか。

	[I]欄	[II]欄	[III]欄
a	カフェイン	安息香酸ナトリウム	固体分散体形成
b	テオフィリン	エチレンジアミン	包接化合物形成
c	ジゴキシン	エタノール	コソルベンシー
d	ビタミンA	ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油 60	ミセル内取り込み
e	プロスタグランジン E ₁	シクロデキストリン	イオン対形成

- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (b, e) 4 (c, d) 5 (d, e)

正解 4

第93回

問 279 (薬剤) ヒルドイドローション 0.3%に含まれる添加物とその役割との組み合わせのうち、正しいのはどれか。1つ選べ。

	添加物	役割
1	グリセリン	緩衝剤
2	パラオキシ安息香酸エチル	保存剤
3	セタノール	抗酸化剤
4	白色ワセリン	乳化剤
5	モノステアリン酸グリセリン	等張化剤

正解 2

第99回

問 276-277 病院薬剤部において、以下の A~D の注射剤を購入して保管することになった。

	A	B	C	D
製剤名	注射用アムホテリシン B	アルプロスタジル注射液	人血清アルブミン製剤	ジアゼパム注射液
分類	毒薬	劇薬	特定生物由来製品	向精神薬
添加物	デスオキシコール 酸ナトリウム 無水リン酸一水素 ナトリウム 無水リン酸二水素 ナトリウム	精製ダイズ油 高度精製卵黄レシチン オレイン酸 濃グリセリン 水酸化ナトリウム	アセチルトリプトファン カプリル酸 水酸化ナトリウム 炭酸水素ナトリウム 氷酢酸 塩化ナトリウム	ペンジルアルコール プロピレングリコール 無水エタノール 安息香酸 水酸化ナトリウム pH 調整剤

問 276 (実務) 保管管理方法について、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 A は、常に施錠して保管しなければならない。
- 2 B は、常に施錠して保管しなければならない。
- 3 C は、室温で保存可能であり、その有効期間は検定合格の日から 3 年である。
- 4 D は、医療従事者が常時在室するなど注意している場合を除き、施錠して保管しなければならない。

正解 1、4

問 277 (薬剤) 添加物の中に界面活性剤が乳化剤として含まれているのはどれか。1つ選べ。

- 1 A 2 B 3 C 4 D

第97回

正解 2

問 341 ペン型インスリン製剤を患者に交付した後の使用方法及び保管方法の記述のうち、適切なのはどれか。2つ選べ。

- 1 使用前には空打ちを行う。
- 2 毎日同一部位に注射する。
- 3 未使用の製剤は、凍結して保管する。
- 4 未使用の製剤は、室温で保管する。
- 5 使用開始後の製剤は、室温で保管する。

第98回

正解 1、5

問 284-285 47 歳男性。気管支ぜん息の治療中である。この患者に以下の薬剤が新たに処方された。

(処方)

アドエア 125 エアゾール 120 吸入^(注) 1 回 2 吸入

1 日 2 回 朝夕食後 吸入 全 1 個

注：サルメテロールキシナホ酸塩及びフルチカゾンプロピオン酸エステルを含有する加圧式定量噴霧吸入器 (pMDI)。1 吸入で、サルメテロールとして 25 μg 及びフルチカゾンプロピオン酸エステルとして 125 μg を吸入できる。

問 284 (実務)

この患者に対する服薬指導の内容として、適切でないのはどれか。1 つ選べ。

- 1 ぜん息発作重積状態の時に使用してもよい。
- 2 用時振とうして使用すること。
- 3 吸入ステロイド薬単独使用時と比べ、ステロイド薬の減量が可能である。
- 4 発作が起こらなくても毎日定期的に使用する。
- 5 薬剤噴霧と吸入のタイミングを同調できない時には、スパーサーの使用を勧める。

正解 1

問 285 (薬剤)

この薬剤に関する記述のうち、正しいのはどれか。1 つ選べ。

- 1 全身作用を目的とした吸入エアゾール剤である。
- 2 肺深部まで薬物を送達させるために、エアゾール粒子の空気力学径が 30~100 μm の大きさに設計されている。
- 3 速く吸入する方が吸入効率がよい。
- 4 吸入後に息を止める必要はない。
- 5 容器は、密封容器である。

第98回

正解 5

問 280-281 70 歳男性。同居している家族がインフルエンザを発症したので、予防のために近医を受診したところ以下の処方が出された。

(処方) ザナミビル水和物ドライパウダーインヘラー 全 20 ブリスター

1 回 2 ブリスター、1 日 1 回 10 日間吸入

問 281 (薬剤) 本吸入剤に関する記述のうち、正しいのはどれか。2 つ選べ。

- 1 添加されている乳糖粒子は、薬物粒子同士の過度な凝集を抑える働きがある。
- 2 薬物粒子は、吸入時に効率よく気道に到達する空気力学径である 20 μm 前後の粒子径に設計されている。
- 3 薬物粒子が吸湿すると流動性が低下するため、防湿性の包装が施されている。
- 4 吸入時に、薬物粒子が二次粒子を形成するように設計されている。

正解 1, 3

(第 100 回)

問 288 68歳女性。体重 51kg。副腎皮質ステロイド薬の吸入エアゾール剤で気管支ぜん息の治療を受けていた。しかし、噴霧と吸気のタイミングを合わせることができず、以下の処方に変更された。

(処方)

パルミコート 200 μg タービュヘイラー56 吸入^(注) 1回 1吸入

1日 2回 朝夕食後 吸入 全 1本

(注：ブデソニド 1回吸入量 200 μg のドライパウダー吸入式ステロイド薬)

この薬剤とピークフローメーターに関する指導内容として、適切なのはどれか。2つ選べ。

- 1 まず息を吐いてから、薬物を深く吸い上げるように指導した。
- 2 この薬剤のマウスピースが汚れた場合には、水洗いするように指導した。
- 3 この薬剤の有効成分は、肺内に到達後、活性体になることを説明した。
- 4 ピークフローメーターは、最大吸気流量を簡便に測定するものであることを説明した。
- 5 ピークフロー値は、気管閉塞の状態の客観的な指標なので、毎日測定するように指導した。

第98回

正解 1、5

問 329 図は吸入粉末剤（ドライパウダー）の吸入の様子を示したものである。吸入方法として、最も適切なのはどれか。1つ選べ。



吸入器を口から放して吸う。



吸入器を下に向けて吸う。



吸入器を水平にして吸う。



吸入器を上に向けて吸う。



鼻から吸う。

正解 3

第98回

問 238-239 41 歳男性。就寝中に胸部圧迫感が出現。近医で検査の結果、冠攣縮性狭心症と診断され、薬物療法が開始された。患者情報は以下の通りである。

血圧 130/75 mmHg、心拍数 58 回/分、呼吸数 14 回/分

喫煙 30 本/日、飲酒 ビール 350mL×3 本/日、営業職で残業が多い
(処方)

ニフェジピン徐放錠 20 mg (24 時間持続) 1 日 1 回(1 回 1 錠)
就寝前 14 日分

速効性ニトログリセリンエアゾール剤 0.3 mg 1 本
胸痛発作時回 1 噴霧

問 238 (実務) 薬剤交付時に患者に伝えるべき注意事項として、適切なのはどれか。2 つ選べ。

- 1 内服薬は、副作用として低血糖を起こしやすい。
- 2 内服薬の効果が現れにくくなるので、納豆を摂取することは避ける。
- 3 内服薬は、症状が改善しでも自己判断での服薬の中断はしない。
- 4 エアゾール剤は、発作時の痛みの程度に応じて噴霧回数を調節する。
- 5 エアゾール剤は、噴霧孔を上にして垂直に立てて持ち、噴霧孔をできるだけ口に近づけて噴霧する。

正解 3, 5

(第 100 回)

問 196-199 慢性動脈閉塞症（バージャー病）の 65 歳男性。安静時にも疼痛を訴えるため、医師からプロスタグランジン E₁（アルプロスタジル）注射剤を投与したいと、朝のカンファレンスにおいて提案があった。プロスタグランジン E₁ 製剤として、 α -シクロデキストリンを含む**注射用アルプロスタジルアルファデクス**と、リポ化製剤の**アルプロスタジル注射液**が院内で、採用されている。医師は、2つの製剤に関する情報提供を薬剤師に求めた。

問 196（実務）注射用アルプロスタジルアルファデクスは、 α -シクロデキストリン及び、乳糖水和物を含む用時溶解型の凍結乾燥製剤である。提供する情報として、誤っているのはどれか。1つ選べ。

- 1 溶解液には、生理食塩液を用いる。
- 2 溶解後 1 時間経過したものは、廃棄する。
- 3 静脈及び動脈内に持続的な投与が可能である。
- 4 本剤による治療は、対症療法に位置づけられる。
- 5 出血している患者には投与しない。

正解 2

（第 100 回）

問 197（実務）アルプロスタジル注射液 10 μ g は、以下の組成のリポ化製剤である。

アルプロスタジル	10 μ g
精製ダイズ油	200 mg
高度精製卵黄レシチン	36 mg
オレイン酸	4.8 mg
濃グリセリン	44.2 mg
pH 調整剤	

薬剤師が、医師に対して提供するアルプロスタジル注射液の情報として、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 澄明な溶液である。
- 2 凍結して保存する。
- 3 5%ブドウ糖注射液に混和して、点滴静注することができる。
- 4 ポリ塩化ビニル製の輸液セットを用いる必要がある。
- 5 病変部位に集積する性質をもつ

正解 3, 5

（第 100 回）

問 198 (物理・化学・生物) 注射用アルプロスタジルアルファデクス中の α -シクロデキストリンは、プロスタグランジン E_1 をモル比 1:1 で包接する。注射用アルプロスタジルアルファデクス(20 μg)を 25°C、1mL 注射用水に溶解した。この時、65%のプロスタグランジン E_1 が α -シクロデキストリンから解離していた。プロスタグランジン E_1 の α -シクロデキストリンへの包接化の平衡定数($\text{L}\cdot\text{mol}^{-1}$) として最も近いのはどれか。1つ選べ。ただし、この注射用粉末にはプロスタグランジン E_1 が 56.4 nmol、 α -シクロデキストリンが 68 nmol 含まれるとする。

- 1 8.1×10^2 2 9.0×10^2 3 9.0×10^3 4 8.1×10^4
5 9.0×10^5

正解 1

(第 100 回)

問 199 (物理・化学・生物) リポ化製剤であるアルプロスタジル注射液は、ダイズ油を分散体の主成分とする油滴分散体である。この分散体を球体としたとき、分散体の内圧は、外圧に対してどの程度高いか。最も近い値はどれか。1つ選べ。ただし、以下に示すヤング・ラプラスの式が成り立つとし、油滴分散体の直径は、約 120 nm、分散体の主成分であるダイズ油の注射液界面に対する界面ギブズエネルギーは、25 mJ/m^2 とする。ただし、分散体中の界面活性剤の影響はないものとする。

$$\Delta P = \gamma \cdot \frac{2}{r} \quad (\Delta P : \text{液滴内外の圧力差}, \gamma : \text{界面張力}, r : \text{液滴の半径})$$

- 1 $8.3 \times 10^4 \text{ Pa}$ 2 $1.7 \times 10^5 \text{ Pa}$ 3 $4.2 \times 10^5 \text{ Pa}$
4 $8.3 \times 10^5 \text{ Pa}$ 5 $1.7 \times 10^6 \text{ Pa}$

正解 4

(第 100 回)

問 266-267 65 歳女性。老年内科を受診し、骨粗しょう症と診断され、下記の処方が出された。

(処方) **リセドロン酸 Na 錠** 17.5 mg 1 回 1 錠(1 日 1 錠)

毎週水曜日 起床時 4 日分(投与実日数)

問 266 (実務) 薬剤師が行う服薬指導の内容として適切なものはどれか。2 つ選べ。

- 1 180 mL 程度の十分な量の水と一緒に服用するよう指導した。
- 2 嚙んだり、口中で溶かしたりせずに服用するよう指導した。
- 3 起床後、食事を摂ってから服用するよう指導した。
- 4 服用を忘れた場合には、気がついたときにすぐ服用するよう指導した。

正解 1, 2

(第 100 回)

問 267 (薬剤) この患者は、日常的に牛乳を飲用していることがわかった。リセドロン酸 Na 錠の牛乳による服用についての記述のうち、正しいのはどれか。1 つ選べ。

- 1 牛乳中の油脂成分によりリセドロン酸の溶解が促進され良好に吸収される。
- 2 牛乳中の油脂成分により胃粘膜が保護されるので、服用後、すぐに横になって良い。
- 3 リセドロン酸は、牛乳中のカルシウムイオンとキレートを形成するので、吸収が低下する。
- 4 カルシウム補給のためにも、牛乳での服用が推奨されている。
- 5 リセドロン酸は、牛乳中の成分とは特に相互作用しないので、水で服用した場合と比べて、吸収に違いは認められない。

正解 3

(第 100 回)

問 270-271 腎移植を受けた患者が退院間近になり、病棟担当薬剤師が退院時服薬指導のために病室を訪問した。

患者から、「移植コーディネーターから、退院後の食生活で特にセントジョーンズワートや柑橘類、生魚などの摂取は控えるように言われているのですが、どのような理由なのでしょう」との質問があった。なお、当該患者にはシクロスポリンが処方されている。

問 271 (薬剤) シクロスポリンの経口投与時の体内動態および投与設計に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 シクロスポリンの投与量は、腎移植後の日数に関わらず一定に保つことが推奨される。
- 2 シクロスポリンの投与設計は、一般にトラフ濃度に基づいて行われる。
- 3 シクロスポリンによる腎移植後の拒絶反応のコントロールが不良の場合は、シクロスポリンとタクロリムスの併用を行う。
- 4 血清クレアチニン値の上昇が観察された場合は、シクロスポリンによる副作用の可能性があるので、直ちに休薬する必要がある。
- 5 自己乳化型マイクロエマルジョン製剤投与後のシクロスポリンの消化管吸収は、胆汁分泌量や食事の影響を受けにくい。

正解 2, 5

(第 100 回)

5. 製剤化の方法

- ① 製剤化の単位操作および汎用される製剤機械
- ② 単位操作を組み合わせた代表的製剤の調製
- ③ 汎用される容器、包装の種類や特徴

問171 日本薬局方通則に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 滴数を量るには、20℃において「常水」20滴を滴加するとき、その質量が0.90～1.10gとなるような器具を用いる。
- b 常温は15～25℃とする。
- c 定量に供する試料の採取量に「約」を付けたものは、記載された量の±10%の範囲をいう。
- d 0.05gを精密に量る場合、適切なはかりを用いて0.045～0.054gを量る。

1 (a、b)

2 (a、c)

3 (a、d)

4 (b、c)

5 (b、d)

6 (c、d)

第96回

正解 4

問172 日本薬局方通則に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a 溶液の濃度を(1→3)で表示したものは、液状の薬品ではその1gを溶媒に溶かして全量を3mLとする割合を示す。
- b 定量に供する試料の採取量に「約」を付けたものは、記載された量の±5%の範囲をいう。
- c 試験又は貯蔵に用いる温度を表すとき、室温とは1～30℃とする。
- d 質量百万分率の単位には「vol ppm」の記号が用いられる。

	a	b	c	d
1	正	正	正	誤
2	誤	正	誤	正
3	正	正	誤	誤
4	誤	誤	正	正
5	誤	誤	正	誤

第92回

正解 5

問173 日本薬局方通則及び製剤総則に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 医薬品の試験の操作において、「直ちに」とあるのは、通例、前の操作の終了から3分以内に次の操作を開始することを意味する。
- b 医薬品の力価は、通例、一定の生物学的作用を現す一定の標準品量で示され、医薬品の種類によって異なる。
- c 液剤は、液状の内用剤又は外用剤で、製剤総則中の他の製剤各条に該当しないものをいう。
- d 眼軟膏剤は、結膜嚢に適用する無菌に製した軟膏剤であり、本剤に含まれる医薬品粒子の大きさは、通例、150 μm 以下である。

- 1 (a, b) 2 (a, c) 3 (a, d)
4 (b, c) 5 (b, d) 6 (c, d) 第95回

正解 4

問 52 空気で吹き上げた原料粉体に結合剤溶液を噴霧して造粒する方法はどれか。1 つ選べ。

- 1 噴霧乾燥造粒法 2 攪拌造粒法 3 流動層造粒法
4 押し出し造粒法 5 乾式造粒法

正解 3

第97回

問 179 製剤化に関する記述のうち、正しいのはどれか。2 つ選べ。

- 1 乾式顆粒圧縮法は、水分や熱に対して不安定な薬物を錠剤化するのに適する。
- 2 糖衣コーティングは、フィルムコーティングと比較して工程に要する時間が短い。
- 3 滴下法による軟カプセル剤の製造では、薬物の充てんとカプセル被膜の形成が同時に行われる。
- 4 凍結乾燥法で注射剤を製造する場合、賦形剤を添加することはできない。

正解 1, 3

第97回

問 177 造粒法に関する記述のうち、誤っているのはどれか。1つ選べ。

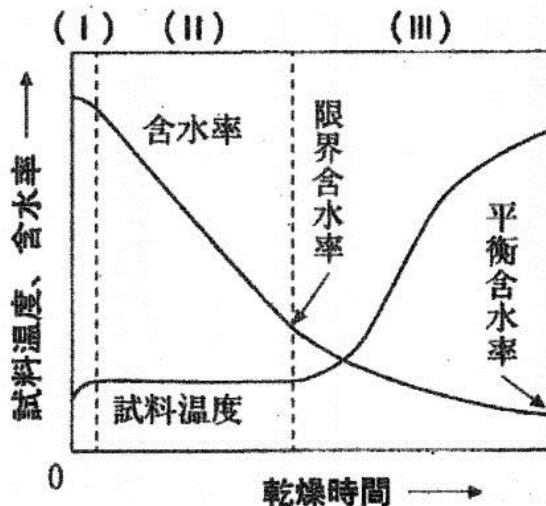
- 1 破碎造粒法は、混合した粉末状の原料を圧縮成形した後、粉碎する方法なので、不定形の造粒物が得られる。
- 2 攪拌造粒法は、攪拌翼を高速回転させながら、結合剤溶液を噴霧して造粒する方法なので、重質で球形の造粒物が得られる。
- 3 噴霧乾燥造粒法は、熱風気流中に薬物と添加剤からなる溶液もしくは懸濁液を噴霧し、急速に乾燥する方法なので、球形の造粒物が得られる。
- 4 流動層造粒法は、熱風気流中に吹き上げた粉末に結合剤を噴霧して造粒する方法なので、流動層内で圧密化を受け、重質で球形の造粒物が得られる。
- 5 押し出し造粒法は、一定孔径のスクリーンから薬物と添加剤からなる混練物を押し出し、適当なサイズでカットして造粒する方法なので、円柱状の造粒物が得られる。

正解 4

第98回

問 178 下図は、乾燥工程中における乾燥時間と試料温度及び試料の含水率との関係を表している。乾燥に関する以下の記述のうち正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 乾燥初期の期間（Ⅰ）では、試料温度の上昇にエネルギーが消費されるので、乾燥速度は低下する。
- 2 試料の含水率は、全乾燥工程中、直線的に減少する。
- 3 期間（Ⅱ）では、加える熱量と水分の蒸発に伴う気化熱が等しくなり、乾燥速度及び試料温度はほぼ一定となっている。
- 4 限界含水率より含水率が低くなる期間（Ⅲ）では、試料温度が上昇しても、乾燥速度は低下する。
- 5 乾燥終了時には、含水率は0%になっている。



正解 3、4

第100回

問173 錠剤及びトローチ剤の製造に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

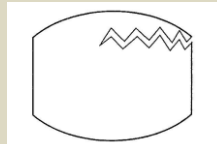
- a スラッキングは、湿式顆粒圧縮法で用いられる。
- b トローチ剤の製造では、崩壊剤は用いない。
- c 打錠障害であるキャッピングやラミネーションは、結合剤の過剰な添加や滑沢剤の不足などが発生の原因とされる。
- d 口腔内崩壊錠の製法のひとつに、圧縮成型を行わない湿製法がある。

- 1 (a、b) 2 (a、c) 3 (a、d)
 4 (b、c) 5 (b、d) 6 (c、d) 第96回

正解 5

問 53 図のように錠剤の上部が剥離する打錠障害はどれか。1つ選べ。

- 1 キャッピング 2 スティッキング
 3 スラッキング 4 バインディング
 5 ケーキング



第99回

正解 1

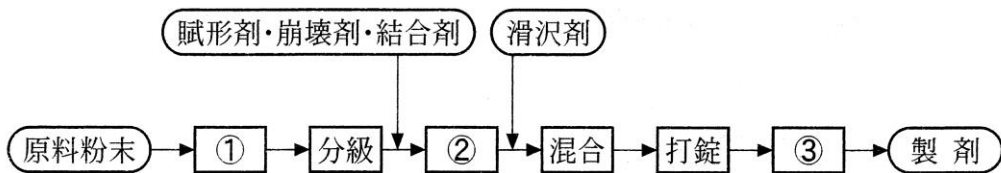
問175 〔Ⅰ〕欄に打錠の際に発生する障害の種類、〔Ⅱ〕欄に障害の状態、〔Ⅲ〕欄に障害が発生する原因の一つが記述してある。正しい組合せはどれか。

〔Ⅰ〕欄	〔Ⅱ〕欄	〔Ⅲ〕欄
1 キャッピング		圧縮応力が不均一
2 ラミネーション		結合剤量が不足
3 バインディング		滑沢剤量が不足
4 ピッキング		顆粒中の水分が不足
5 スティッキング		結合剤量が不足

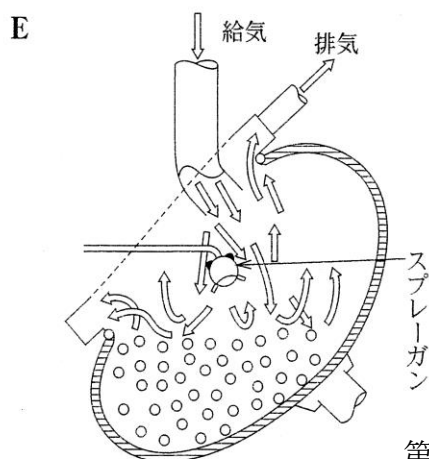
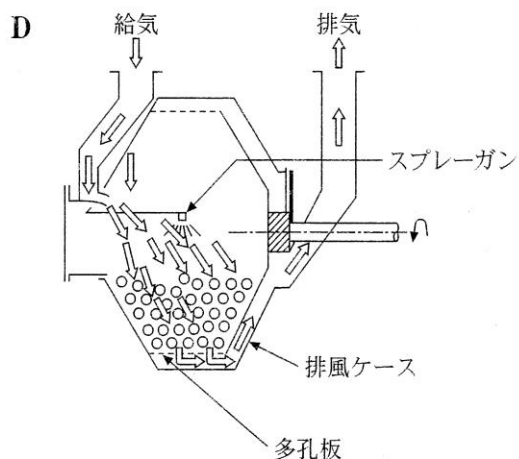
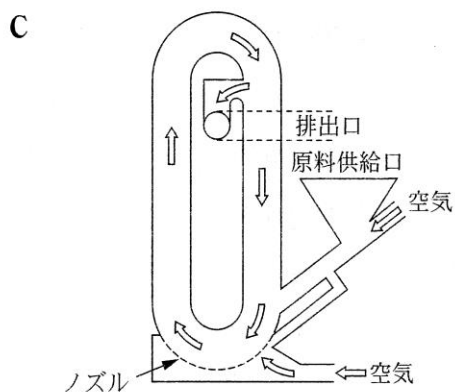
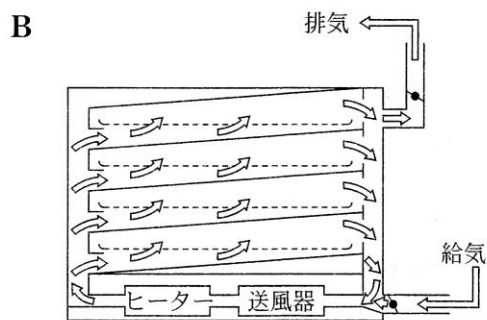
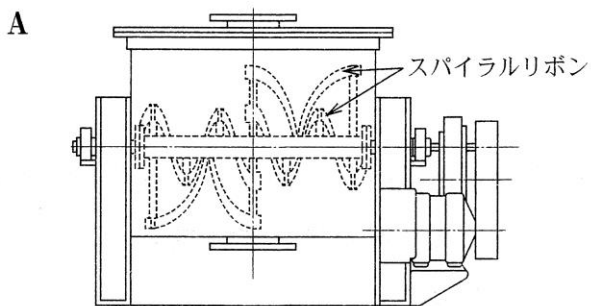
正解 3

第93回

問176 次図はフィルムコーティング錠の製造工程の例である。下のA～Eは各種製剤機械の模式図を示す。単位操作①～③に用いられる装置に関して、正しい組合せはどれか。ただし、図中の矢印(⇨)は空気の流れを示す。



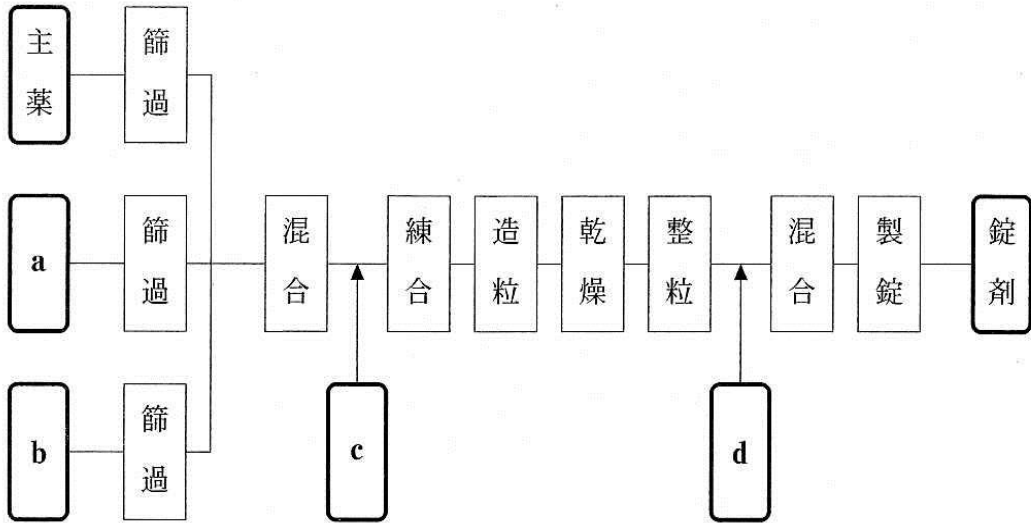
	①	②	③
1	A	B	E
2	A	D	C
3	B	A	D
4	B	C	E
5	C	A	D
6	C	B	E



正解 5

第91回

問176 湿式顆粒圧縮法による錠剤の製造過程について、a、b、c、dのそれぞれに入れるべき添加剤として正しい組合せはどれか。



	a	b	c	d
1	ステアリン酸マグネシウム	ヒドロキシプロピルセルロース	乳糖	クロスカルメロースナトリウム
2	乳糖	クロスカルメロースナトリウム	ヒドロキシプロピルセルロース	ステアリン酸マグネシウム
3	ステアリン酸マグネシウム	クロスカルメロースナトリウム	ヒドロキシプロピルセルロース	乳糖
4	乳糖	ヒドロキシプロピルセルロース	クロスカルメロースナトリウム	ステアリン酸マグネシウム
5	乳糖	クロスカルメロースナトリウム	ステアリン酸マグネシウム	ヒドロキシプロピルセルロース

正解2

第94回

問177 製剤機械に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a ロータリー型打錠機、エキセントリック型(単発型)打錠機のいずれにおいても、錠剤の質量は充填時の下杵の位置で調整できる。
- b V型混合機では、操作条件により理想的な混合が得られ、混合状態は粉体の性質の影響をほとんど受けない。
- c 流動層造粒装置は、転動している粉体に結合剤溶液を噴霧するもので、円柱形の粒子が得られる。
- d ジェットミルは、気体の流体エネルギーによって粉碎を行うもので、主として粒子間的高速衝突によって粉碎が促進される。

1 (a、b)

2 (a、c)

3 (a、d)

4 (b、c)

5 (b、d)

6 (c、d)

第88, 95回

正解 3

問176 製剤のコーティングに関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a フィルムコーティングは、シュガーコーティングに比べて工程数が多く、コーティングに要する時間も長い。
- b 錠剤のシュガーコーティングは、素錠への水分移行を防ぐために防水膜で被覆した後に行う。
- c 顆粒剤やカプセル剤には、フィルムコーティングを施すことができない。
- d ヒプロメロースフタル酸エステルは、腸溶性コーティング剤として使用される。

1 (a、b)

2 (a、c)

3 (a、d)

4 (b、c)

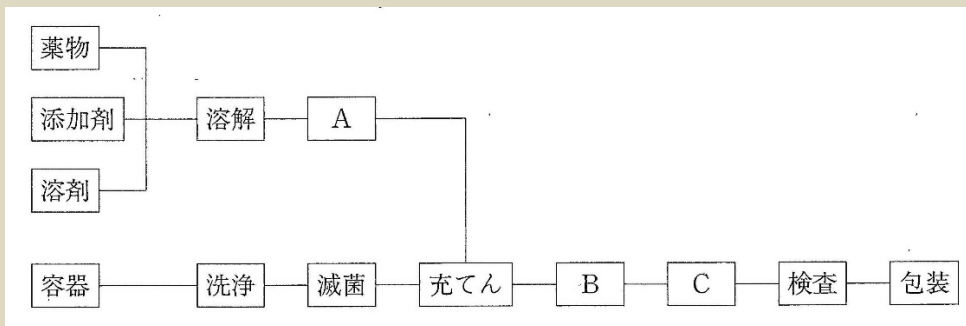
5 (b、d)

6 (c、d)

第96回

正解 5

問 180 凍結乾燥注射剤を製造するプロセス中の A、B、C にあてはまる単位操作の正しい組合せはどれか。1つ選べ。



	A	B	C
1	凍結乾燥	ろ過滅菌	密封
2	凍結乾燥	密封	ろ過滅菌
3	ろ過滅菌	凍結乾燥	密封
4	ろ過滅菌	密封	凍結乾燥
5	密封	ろ過滅菌	凍結乾燥
6	密封	凍結乾燥	ろ過滅菌

正解 3

第99回

問 200-201 医師から組換え医薬品に関する情報を求められた。そこで、薬剤師が組換え医薬品について情報収集を行った。

問 201 (物理・化学・生物) 組換え医薬品に分類される抗体医薬品は凍結乾燥品であることが多い。組換え医薬品の凍結乾燥に関する記述の①、②の組合せとして適切なのはどれか。1つ選べ。

「水に溶けている試料の凍結乾燥品を調製する場合、水の変化を表す主たる現象は (①) である。また(①)の現象の転移エンタルピーは、(②) のプロットの傾きから求められる。ただし、相転移温度と蒸気圧との関係は、次に示すクラペイロン・クラウジウスの式により表される。」

$$\frac{dp}{dT} = \frac{p\Delta_{trs}H}{RT^2}$$

p : 圧力、T : 温度、 $\Delta_{trs}H$: 転移エンタルピー変化、R : 気体定数

	①	②
1	昇華	x 軸 : $1/T^2$ 、y 軸 : $1/p$
2	蒸発	x 軸 : $1/T^2$ 、y 軸 : $1/p$
3	昇華	x 軸 : T^2 、y 軸 : p
4	蒸発	x 軸 : T^2 、y 軸 : p
5	昇華	x 軸 : $1/T$ 、y 軸 : $\ln p$
6	蒸発	x 軸 : $1/T$ 、y 軸 : $\ln p$

正解 5

(第 100 回)

問175 滅菌に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 最終滅菌を適用できる医薬品には、通例、 10^{-6} 以下の無菌性保証水準が得られる条件で滅菌を行う。
- b 最終滅菌法では、生存菌数(生存率)を1/100に低下させるのに要する時間(または線量)を decimal reduction value (D 値)という。
- c 微生物殺滅法における方法の1つに照射法がある。
- d 微生物殺滅法におけるガス法では、塩素ガスが広く用いられている。
- e 微生物由来の発熱性物質は、高圧蒸気法やろ過法(孔径 $0.22\mu\text{m}$ フィルター)で破壊あるいは除去できる。

1 (a, b)

2 (a, c)

3 (b, c)

4 (b, e)

5 (c, d)

6 (d, e)

第91回

正解2

問175 滅菌法及び無菌性保証に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 滅菌とは、物質中の病原性を示す微生物を殺滅又は除去することをいう。
- b 最終滅菌法には、加熱法、照射法、ガス法、ろ過法がある。
- c 高圧蒸気法では、乾熱法よりも高温で滅菌が行われる。
- d 超ろ過法により注射用水を製することができる。
- e 培地充てん試験法は、無菌操作法で製造される医薬品の無菌性保証の適切性を検証する方法である。

1 (a, b)

2 (a, e)

3 (b, c)

4 (c, d)

5 (d, e)

第94回

正解5

問176 滅菌法に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 乾熱法は、熱に安定なガラス製、磁製、金属製の物品、鉱油、油脂類又は粉体の試料などに用いられる。
- b 十字流ろ過方式による超ろ過法では、すべての微生物及びエンドトキシンを除去することが可能である。
- c ガス法では、塩素ガスが広く用いられる。
- d 放射線法では、 β 線を利用することで熱に不安定な製品の滅菌が可能である。

1 (a, b)

2 (a, c)

3 (a, d)

4 (b, c)

5 (b, d)

6 (c, d)

第93回

正解1

問 179 滅菌に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ

- 1 最終滅菌法を適用できる医薬品には、通例、 10^{-4} 以下の無菌性保証水準が得られる条件で滅菌が行われる。
- 2 通常、医薬品の分解における活性化エネルギーは、滅菌の活性化エネルギーに比べて大きい。
- 3 加熱滅菌における微生物の死滅は、見かけ上2次速度過程となる。
- 4 発熱性物質（パイロジェン）は、 250°C 、30分以上の乾熱滅菌で破壊される。
- 5 医療器具や衛生材料の滅菌には、酸化エチレンガスが広く用いられる。

正解 4、5

第100回

問 178 医薬品を保存する容器・包装に関する記述のうち、正しいのはどれか。1つ選べ。

- 1 セロファンフィルムは、防湿効果に優れる。
- 2 静脈内投与する注射剤には、プラスチック製容器を用いることはできない。
- 3 吸入粉末剤に用いる容器は、通例、密閉容器とする。
- 4 ピロー包装は、ラミネートフィルムを用いて顆粒剤などを1回服用量ごとに充てんしたものである。
- 5 Press through package (PTP) 包装は、帯状にシール包装された形態をいう。

正解 3

第98回

問176 日本薬局方の医薬品の容器に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a 気密容器の規定がある場合には、密封容器を用いることができる。
- b 密閉容器とは、通常の手扱、運搬又は保存状態において、気体の侵入しない容器をいう。
- c ポリ塩化ビニル製水性注射剤容器には、可塑剤を用いることができない。
- d 輸液用ゴム栓は、輸液として用いる注射剤に使用する内容100 mL以上の容器に用いるゴム栓をいう。

	a	b	c	d
1	正	誤	誤	正
2	誤	正	正	誤
3	正	誤	正	誤
4	誤	正	誤	正
5	正	正	誤	正

正解 1

第92回

問 177 医薬品の容器及び包装に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a. 注射剤容器の遮光については、日本薬局方一般試験法「注射剤用ガラス容器試験法」中に「着色容器の遮光性試験」の規定が定められている。
- b. 密閉容器の規定がある場合には、気密容器を用いることができる。
- c. SP 包装及び PTP 包装は、密封容器である。
- d. 注射剤には、プラスチック製の容器を用いることはできない。

- 1 (a、b) 2 (a、c) 3 (a、d)
4 (b、c) 5 (b、d) 6 (c、d)

第96回

正解 1

問177 医薬品の容器に関する記述のうち、正しいものはどれか。

- 1 SP 包装、PTP 包装、ガラスびんはいずれも気密容器である。
- 2 局方における容器とは、医薬品を入れるもので栓やふたは含まれない。
- 3 エアゾール剤は密閉容器を使用することが規定されている。
- 4 注射剤に着色ガラス容器を用いた場合は、注射剤の不溶性異物検査法は適用されない。
- 5 水性の注射剤にはプラスチック製容器を用いてはならない。

第86, 91回

正解 1

問177 医薬品の包装と容器に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a SP 包装は、錠剤やカプセル剤をポリ塩化ビニルなどを成型したくぼみに入れ、ラミネートフィルムを圧着したものである。
- b セロファンは、透湿性が低いので、防湿性の包装材料として用いられる。
- c エアゾール剤には、密封容器を用いる。
- d プレフィルドシリンジは、薬液あるいは用時溶解・懸濁する薬剤と溶解・分散媒があらかじめ注射器に充てん、滅菌された製剤である。
- e プラスチック製医薬品容器試験法は、注射剤の容器にのみ適用される。

- 1 (a、b) 2 (a、e) 3 (b、c) 4 (c、d) 5 (d、e)

正解 4

第94回

問178 日本薬局方における医薬品の容器に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 医薬品を入れるもので、栓やふたは含まない。
- b 密封容器とは、通常の手扱い、運搬又は保存状態において、固形の異物が混入することを防ぎ、内容医薬品の損失を防ぐことができる容器をいう。
- c 気密容器の規定がある場合には密封容器を用いることができ、密閉容器の規定がある場合には気密容器を用いることができる。
- d 貼付剤は、すべて密閉容器を使用することが規定されている。

- | | | |
|----------|----------|----------|
| 1 (a, b) | 2 (a, c) | 3 (a, d) |
| 4 (b, c) | 5 (b, d) | 6 (c, d) |

第95回

正解 6

問 336 注射剤の投与に際して使用する医療器材に関する記述のうち、正しいのはどれか。
1つ選べ。

- 1 プロポフォール[®]の脂肪乳剤を点滴静注する際に、ポリ塩化ビニル製の輸液セットを使用する。
- 2 ニトログリセリン注射液を乳酸リンゲル液で希釈して点滴静注する際に、ポリ塩化ビニル製の輸液セットを使用する。
- 3 硝酸イソソルビド注射液を5%ブドウ糖注射液で希釈して点滴静注する際に、ポリエチレン製の輸液セットを使用する。
- 4 ダイズ油を主成分とする脂肪乳剤を点滴静注する際に、輸液ラインに微生物ろ過フィルターを装置する。
- 5 ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油を含有するタクロリムス注射液を生理食塩液に希釈して点滴静注する際に、ポリ塩化ビニル製の輸液セットを使用する。

正解 3

第97回

6. 製剤試験法

- ① 日本薬局方の製剤に関連する試験法
- ② 日本薬局方の製剤に関連する代表的な試験法、品質管理への適用

問180 日本薬局方の製剤試験法に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

a 素錠の製剤均一性試験法において、有効成分含量が 25 mg 以上で、かつ製剤中の有効成分の割合が質量比 25 % 以上の場合は、質量偏差試験が適用できる。

b 崩壊試験法において、補助盤の使用は医薬品各条で規定されている場合のみ、使用できる。

c 腸溶性製剤の溶出試験法において、第 1 液で一定時間耐酸性の試験を行った後、その試料を引き続き第 2 液で試験する。

d 徐放性経口製剤の溶出試験法において、試験の操作及び試験液は即放性経口製剤の場合と同じである。

	a	b	c	d
1	正	誤	正	正
2	誤	誤	誤	正
3	正	正	誤	正
4	正	誤	正	誤
5	誤	正	誤	誤

第94回

正解 3

問172 日本薬局方の試験法に関する記述のうち、正しいものはどれか。

1 直径 20.0 mm 以上の大きさの製剤、腸溶性の製剤、徐放性の製剤及び溶出試験の適用を受ける製剤には、崩壊試験法を適用しない。

2 軟カプセル剤の質量偏差試験法は、内容物が固形ではないため内容物を含むカプセル全質量について行う。

3 溶出試験法の 1 つに、フロースルーセル法がある。

4 プラスチック製医薬品容器試験法の透明性試験第 1 法は、容器表面に凹凸やエムボス加工がある容器の試験に適用できる。

5 輸液用ゴム栓は、溶血性試験を行う必要はない。

第91回

正解 3

問179 日本薬局方一般試験法に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 注射剤の不溶性異物検査法は、不溶性異物の有無を肉眼で観察する検査法である。
- b エンドトキシン試験法は、エンドトキシンの存在をウサギの体温変化により判定する試験法である。
- c 製剤均一性試験法は、個々の製剤の間での有効成分含量の均一性を試験する試験法である。
- d 溶出試験法は、経口製剤及び坐剤からの主薬の溶出性を試験する試験法である。

- 1 (a、b) 2 (a、c) 3 (a、d)
4 (b、c) 5 (b、d) 6 (c、d) 第93回

正解 2

問 180 日本薬局方の製剤試験法に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 注射剤の採取容量試験法は、内容物が容器に表示量どおりに正確に充てんされていることを確認する試験法である。
 - 2 点眼剤の不溶性異物検査法は、不溶性異物の大きさ及び数を測定する方法である。
 - 3 限軟膏剤には、無菌試験法が適用される。
 - 4 軟膏剤には、鉍油試験法は適用されない。
- 第97回

正解 3、4

問179 日本薬局方一般試験法に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 浸透圧測定法は、試料のオスモル濃度を凝固点降下法を用いて測定する方法である。
- b 軟カプセル剤の質量偏差試験では、個々の質量から対応するカプセル被包の質量を差し引いた値を内容物の質量として判定する。
- c 熱質量測定法(TG)では、結晶試料の温度上昇にともなって現れる融解ピークから融点を求めることができる。
- d 鉍油試験法は、注射剤及び点眼剤に用いる鉍油の純度を求める方法である。

- 1 (a、b) 2 (a、c) 3 (a、d)
4 (b、c) 5 (b、d) 6 (c、d) 第95回

正解 1

問 53 点眼剤に適用される日本薬局方一般試験法はどれか。1つ選べ。

- 1 アルコール数測定法 2 製剤均一性試験法 3 エンドトキシン試験法
4 発熱性物質試験法 5 無菌試験法

第97回

正解 5

問 53 カールフィッシャー法を用いて測定するのはどれか。1つ選べ。

- 1 沈降速度 2 表面張力 3 水分 4 電気伝導度 5 密度

正解 3

第100回

問177 日本薬局方一般試験法に関する記述のうち、正しいものはどれか。

- 1 カールフィッシャー法は、試料中の水分を測定する方法であり、容量滴定法及び電量滴定法が規定されている。
- 2 比表面積測定法は、気体の物理吸着量から Kozeny-Carman の式に基づいて粉体試料の比表面積を測定する方法である。
- 3 熱分析法は、試料を強熱し、揮発せずに残留する物質の量を測定する方法である。
- 4 粉末X線回折測定法は、結晶性医薬品粉末の粒子径分布を測定するのに有用な方法である。
- 5 回転バスケット法は、内用固形製剤の試験液に対する崩壊性又は抵抗性を試験する方法の一つとして規定されている。

第92回

正解 1

問 55 日本薬局方で散剤に対して規定されている試験法はどれか。1つ選べ。

- 1 エンドトキシン試験法
- 2 不溶性微粒子試験法
- 3 微生物限度試験法
- 4 重金属試験法
- 5 溶出試験法

第98回

正解 5

問179 注射剤に適用される試験法に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 注射剤の採取容量試験法は、表示量よりやや過剰に採取できる量が容器に充てんされていることを確認する試験法である。
- b エンドトキシン試験法の結果に疑義がある場合は、発熱性物質試験法によって最終の判定を行う。
- c 鉍油試験法は、非水性溶剤中の鉍油を定量する方法である。
- d 注射剤の不溶性異物検査法では、肉眼で不溶性異物の観察を行う。

1 (a、b)

2 (a、c)

3 (a、d)

4 (b、c)

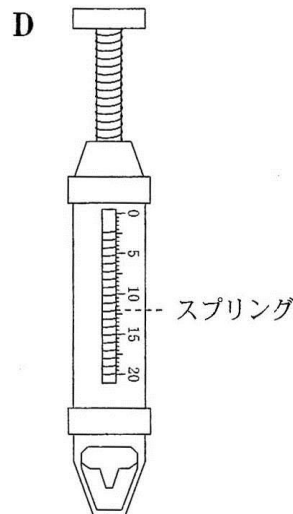
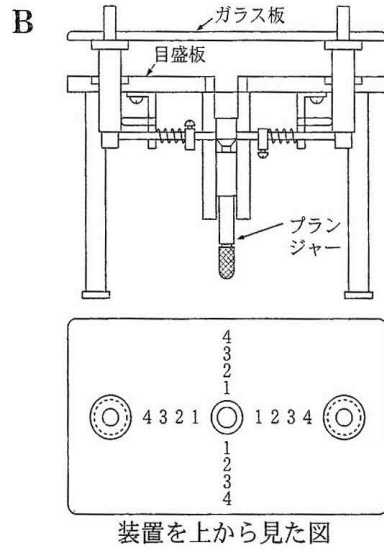
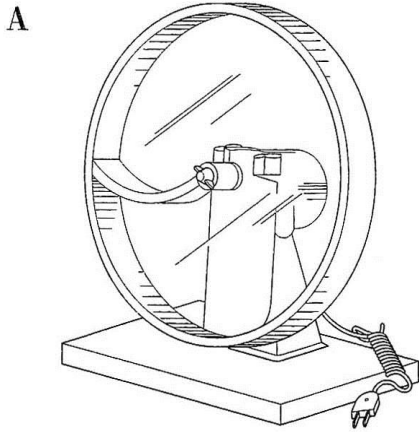
5 (b、d)

6 (c、d)

第96回

正解 3

問180 装置A～Dに関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。



- a 装置Aは、剤皮を施した錠剤に適用され、輸送及び調剤中における剤皮のはがれや剤皮の摩損の度合いを評価するために用いられる。
- b 装置Bは、平行なガラス板に挟んだ試料の経時的な広がりから、軟膏の展延性(伸び)を評価するために用いられる。
- c 装置Cは、試料中で二重円錐針を回転させたときにかかるトルクを測定し、軟膏の粘性を評価するために用いられる。
- d 装置Dは、錠剤の直径方向に力を加え、錠剤の硬度を測定するために用いられる。

1 (a, b)

2 (a, c)

3 (a, d)

4 (b, c)

5 (b, d)

6 (c, d)

第95回

正解5

問174 品質保証に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a GMP(Good Manufacturing Practice)は、わが国へ輸出するための医薬品、医薬部外品を製造する海外の製造所にも適用される。
- b バリデーションは、医薬品の品質、有効性及び安全性を確保するために、最終製品の品質を検査することをいう。
- c GQP(Good Quality Practice)は、製造販売業者が医薬品、医療機器等の品質管理を的確に行うために定められている。
- d GPSP(Good Post-marketing Study Practice)は、製造販売業者が医薬品、医療機器等の市販後の安全管理を的確に行うために定められている。

1 (a、b)

2 (a、c)

3 (a、d)

4 (b、c)

5 (b、d)

6 (c、d)

第93回

正解2

問180 新有効成分含有医薬品の承認申請に必要な安定性試験に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 原則として、日米 EU 医薬品規制調和国際会議(ICH)によって合意されたガイドラインに従って実施される。
- b 承認申請時には、有効期間以上の期間の長期保存試験結果が必要である。
- c 製剤の加速試験は、輸送中に起こりうる貯蔵方法からの長期的な逸脱の影響を評価するために利用できる。
- d 原薬の苛酷試験は、生成の可能性がある分解生成物を同定するのに役立つ。

1 (a、b)

2 (a、c)

3 (a、d)

4 (b、c)

5 (b、d)

6 (c、d)

第93回

正解3

問180 新有効成分含有医薬品の承認申請に必要な安定性試験に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a 長期保存試験は、原薬又は製剤の物理的、化学的、生物学的及び微生物学的性質が有効期間を通じて適正に保持されることを評価する試験である。
- b 加速試験は、申請する貯蔵方法で長期間保存した場合の化学的影響を評価すると同時に、輸送中に起こり得る貯蔵方法からの短期的な逸脱の影響を評価する試験である。
- c 通常、原薬の加速試験は、苛酷試験より苛酷な条件で実施する。
- d 製剤の苛酷試験を実施する場合、光、極端な温度変化、湿度変化及び凍結によって品質の変化が予想される製剤では、その影響を検出できる条件を設定する。

	a	b	c	d
1	正	正	誤	正
2	正	誤	正	誤
3	正	誤	誤	正
4	誤	誤	正	正
5	誤	正	誤	誤

正解 1

第96回

問172 医薬品及び医薬部外品の製造管理及び品質管理の基準(GMP)に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a 医薬品の製造において人為的な誤りを最小限にすることは、この基準の目的のひとつである。
- b 医薬品の製造において品質管理部門と製造部門とを統合することで、合理的に製造と品質管理を行うように定められている。
- c 品質等に関する苦情および製品回収の処理に関する事項は含まれていない。
- d バリデーションとは、製造所の構造設備並びに手順、工程その他の製造管理及び品質管理の方法が期待される結果を与えることを検証し、これを文書化することである。

1 (a, b)

2 (a, c)

3 (a, d)

4 (b, c)

5 (b, d)

6 (c, d)

第96回

正解 3

7. DDSの必要性

- ① 従来の医薬品製剤の有効性、安全性、信頼性における主な問題点
- ② DDSの概念と有用性

8. 放出制御型製剤

- ① 放出制御型製剤(徐放性製剤を含む)の利点
- ② 代表的な放出制御型製剤
- ③ 代表的な徐放性製剤における徐放化の手段
- ④ 徐放性製剤に用いられる製剤材料の種類と性質
- ⑤ 経皮投与製剤の特徴と利点
- ⑥ 腸溶製剤の特徴と利点

問 54 薬物の経口徐放性製剤化の目的として、誤っているのはどれか。1つ選べ。

- 1 薬効の持続
- 2 コンプライアンスの改善
- 3 副作用の軽減
- 4 肝初回通過効果の回避
- 5 血中濃度の急激な上昇の回避

第97回

正解 4

問 41 肝初回通過効果を受ける可能性が高い投与経路はどれか。1つ選べ。

- 1 経口投与
- 2 舌下投与
- 3 経皮投与
- 4 経肺投与
- 5 経鼻投与

第99回

正解 1

問 55 生体に投与後、長時間0次放出を示す製剤はどれか。1つ選べ。

- 1 腸溶性高分子コーティング顆粒
- 2 胃溶性高分子コーティング顆粒
- 3 腸溶性高分子固体分散体顆粒
- 4 ワックスマトリックス型錠剤
- 5 浸透圧ポンプ型錠剤

第100回

正解 5

問 46 薬物の経口投与時におけるバイオアベイラビリティを増加させるのはどれか。1つ選べ。

- 1 消化管内での溶解性の低下
- 2 小腸上皮細胞における膜透過性の低下
- 3 小腸上皮細胞における薬物代謝酵素の誘導
- 4 肝臓における薬物代謝酵素の阻害
- 5 肝臓における胆汁中排泄の促進

第100回

正解 4

問 166 薬物の吸収に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

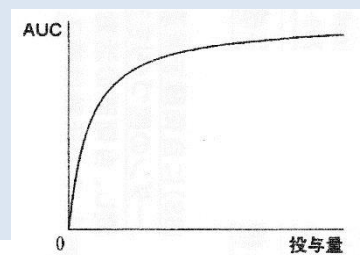
- 1 口腔粘膜から吸収される薬物は、肝初回通過効果を回避できるが、小腸と比較して口腔の粘膜が非常に厚いため、速やかな吸収が期待できない。
- 2 肺からの薬物吸収は、一般に、I型肺胞上皮細胞を介した単純拡散によるものである。
- 3 皮膚の角質層の厚さには部位差があることから、薬物の経皮吸収も部位により大きく異なることがある。
- 4 鼻粘膜は、主に吸収を担う多列絨毛上皮細胞が密に接着していることから、バリア機能が高く、一般に薬物吸収は不良である。
- 5 坐剤の適用は、即効性は期待できるものの、経口投与時と同程度に肝初回通過効果を受ける。

第100回

正解 2, 3

問 48 薬物の経口投与量と血中濃度時間曲線下面積 (AUC) の関係が下図のようになる理由として、最も適切なのはどれか。1つ選べ。

- 1 消化管吸収の飽和
- 2 消化管代謝の飽和
- 3 肝代謝の飽和
- 4 胆汁排泄の飽和
- 5 腎排泄の飽和



正解 1

第100回

問178 放出制御型薬物送達システムに関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a マトリックス型製剤は、膜制御型製剤に比べて一定の薬物放出速度を示す。
- b 時限放出型製剤は、特定の消化管部位での薬物放出を目的として利用される。
- c マトリックスからの薬物放出が Higuchi 式に従う場合、累積薬物放出量は、時間の2乗に対して比例する。
- d 水に不溶性の高分子で皮膜を施した製剤では、リザーバー内の薬物濃度が飽和状態にある期間は、薬物が一定速度で放出される。

	a	b	c	d
1	正	誤	正	誤
2	誤	正	正	誤
3	正	正	誤	正
4	誤	正	誤	正
5	誤	誤	正	正
6	正	誤	誤	誤

第91回

正解 4

問178 DDSに関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a マトリックス型放出制御製剤では、薬物が高分子やワックスなどの基剤中に分散されており、基剤中の薬物分子の拡散や基剤の侵食(エロージョン)、溶解によって薬物が放出制御される。
- b ロンタブは、半透膜で被覆された錠剤であり、浸透圧を利用して徐放性を示す。
- c スパンタブは、フィルムコーティングした徐放性部を核とし、その外側を速放性部で囲み糖衣錠としたものである。
- d リュープロレリン酢酸塩を含有した乳酸-グリコール酸共重合体マイクロスフェアは、皮下投与後4週間にわたって主薬を放出させることができる。

1 (a, b)

2 (a, c)

3 (a, d)

4 (b, c)

5 (b, d)

6 (c, d)

第94回

正解3

問 299 (実務) この患者は、循環器内科の受診後、以下の処方により治療中である。

(処方1)

ニフェジピン徐放錠 20 mg	1回1錠 (1日1錠)
トリクロルメチアジド錠 1 mg	1回1錠 (1日1錠)
オメプラゾール腸溶錠 20 mg	1回1錠 (1日1錠)
	1日1回 朝食後14日分

(処方2)

アルジオキサ錠 100 mg	1回1錠 (1日3錠)
	1日3回 朝昼夕食後14日分

服薬指導中に錠剤が喉につかえやすいとの訴えがあった。上記の処方で、錠剤の粉碎が可能なものはどれか。2つ選べ。

- 1 ニフェジピン徐放錠 20 mg
- 2 トリクロルメチアジド錠 1 mg
- 3 オメプラゾール腸溶錠 20 mg
- 4 アルジオキサ錠 100 mg

第97回

正解2、4

問178 DDS 製剤に関する記述のうち、正しいものの組合せはどれか。

- a ベクロメタゾンプロピオン酸エステル鼻腔内投与製剤は、薬物の全身循環への吸収を目的としたものである。
- b 硝酸イソソルビドを含有する経皮吸収型製剤は、狭心症発作時の救急処置に用いられる。
- c リュープロレリン酢酸塩を含有する乳酸・グリコール酸共重合体を用いたマイクロカプセルの注射剤は、薬物の持続的放出を目的としたものである。
- d プロゲステロンを含有する子宮内投与製剤は、主薬を長期間放出することで避妊効果を発現する。

1 (a, b)

2 (a, c)

3 (a, d)

4 (b, c)

5 (b, d)

6 (c, d)

第92回

正解 6

問 284-285 70 歳男性。1 年ほど前から夜間頻尿、残尿感を認めていたので、近くの泌尿器科を受診した。前立腺肥大症と診断され、以下の薬剤が処方された。

(処方 1) ハルナール®D 錠 0.2 mg^(註) 1 回 1 錠(1 日 1 錠)

1 日 1 回朝食後 14 日分

(注:タムスロシン塩酸塩 0.2 mg を含有する口腔内崩壊錠)

問 285(薬剤) 処方された口腔内崩壊錠に関する記述のうち、正しいのはどれか。2 つ選べ。

- 1 錠剤表面が、水不溶性高分子でコーティングされている。
- 2 錠剤表面が、腸溶性高分子でコーティングされている。
- 3 口腔粘膜からの薬物吸収を期待した製剤である。
- 4 滑沢剤として、ステアリン酸塩が添加されている。
- 5 水に溶解易い糖類が、添加されている。

(第 100 回)

正解 4, 5

問 280-281 35 歳男性。てんかんの持病があり、処方 1 によりコントロールされていた。

(処方 1)

デパケン R 錠 200^{注)} 1 回 2 錠 (1 日 2 錠)
1 日 1 回 朝食後 30 日分

(注：バルプロ酸ナトリウム 200 mg を含む徐放錠)

あるとき、2 日間激しい下痢が続き、救急外来を受診した。患者からの聴取により黄色ブドウ球菌による食中毒が疑われた。医師が処方 2 を追加する際に、薬剤師に意見を求めてきた。

(処方 2)

アンピシリン水和物カプセル 250 mg 1 回 2 カプセル (1 日 8 カプセル)
1 日 4 回 6 時間毎 5 日分
ビフィズス菌錠 12 mg 1 回 1 錠 (1 日 3 錠)
1 日 3 回 朝昼夕食後 5 日分

問 280 (実務)

医師に対する情報提供として、適切なのはどれか。2 つ選べ。

- 1 ロベラミド塩酸塩カプセル 1 mg を追加すべきである。
- 2 バルプロ酸の血中濃度の低下を懸念して、TDM を実施すべきである。
- 3 バルプロ酸の副作用リスクが高まるため、肝機能検査を実施すべきである。
- 4 ビフィズス菌錠は、耐性乳酸菌錠に変更すべきである。
- 5 アンピシリンは、バルプロ酸との相互作用により中枢性けいれんを誘発するので、併用禁忌である。

正解 1, 3

問 281 (薬剤)

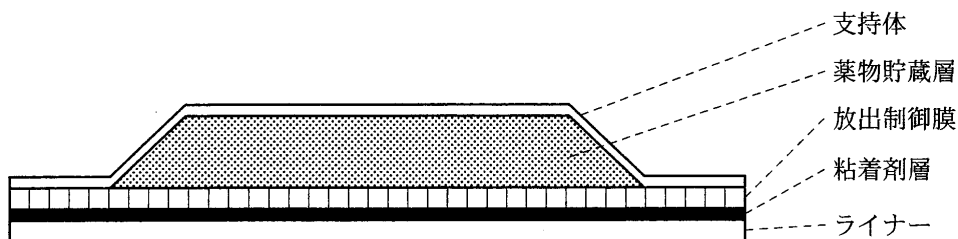
デパケン R 錠は、マトリックス型の徐放錠である。マトリックス型徐放錠の特徴に関する記述のうち、正しいのはどれか。1 つ選べ。

- 1 服用後速やかに崩壊し、内包された徐放性顆粒から薬物が放出される。
- 2 速放性顆粒と徐放性顆粒を混合し、打錠した製剤である。
- 3 徐放層と速放層の 2 層からなる錠剤である。
- 4 速放性の外殻層と徐放性の内殻錠からなる錠剤である。
- 5 基剤中に薬物が均一に分散している。

第98回

正解 5

問 165-166 図はある経皮吸収型製剤の模式図（断面図）である。本剤に関する以下の問に答えよ。



問 165 本剤に関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a. 薬物貯蔵層内の薬物が飽和濃度に保たれているとき、定常状態での薬物の放出制御膜透過速度は Fick の第 1 法則に従う。
- b. 水溶性薬物の皮膚透過性改善が期待できる。
- c. 放出制御膜には乳酸・グリコール酸共重合体が用いられる。
- d. ニトログリセリンを主薬とした本剤を狭心症発作時に貼付することで、速やかな症状寛解が期待できる。

	a	b	c	d
1	誤	誤	誤	正
2	誤	正	正	誤
3	正	誤	誤	正
4	誤	正	誤	正
5	正	誤	正	誤
6	正	誤	誤	誤

正解 6

問 166 本剤（有効面積 9 cm^2 ）を皮膚に適用したところ、定常状態での血中薬物濃度が 0.3 ng/mL となった。皮膚適用時、本剤 1 cm^2 あたり 24 時間に吸収される薬物量（mg）に最も近い値はどれか。ただし、この薬物の全身クリアランスを 10 L/min とする。

- 1 0.5 2 1.5 3 3.6 4 4.3 5 12 6 33 第95回

正解 1

問 282-283

モルヒネの副作用としての便秘がひどくなり、処方変更がなされた。

(従来処方)

モルヒネ硫酸塩水和物徐放錠 30 mg 1回1錠 (1日2錠)
1日2回 朝夕食後 3日分

(変更処方)

フェントステープ 2 mg ^(注) 1回1枚 (1日1枚)
1日1回 就寝前 3日分 (全3枚)

(注：フェンタニルクエン酸塩 2 mg を含む経皮吸収型製剤)

問 282 (実務)

疼痛緩和治療に関する記述のうち、適切なのはどれか。2つ選べ。

- 1 上記の処方変更は、オピオイドローテーションの一例である。
- 2 WHO 方式 3 段階がん疼痛治療ラダーの第 1 段階では、非ステロイド性抗炎症薬 (NSAIDs) かペンタゾシンのいずれかが用いられる。
- 3 フェントステープへの切り替えの際は、レスキュードーズを考慮する必要がある。
- 4 フェントステープ使用時には、NSAIDs などの鎮痛補助剤の併用は避けるべきである。

正解 1, 3

問 283 (薬剤)

今回処方されたフェントステープに関する記述のうち、誤っているのはどれか。1つ選べ。

- 1 支持体、薬物を含む膏体及びライナーから構成される。
- 2 貼付 24 時間後も、製剤中に薬物が残存している。
- 3 膏体を構成するスチレン・イソプレン・スチレンブロック共重合体は、水に不溶である。
- 4 高温とならない所に保管する。
- 5 ハサミ等で切って使用しても差しつかえない。

第98回

正解 5

問 276-277 65 歳男性。変形性関節症の治療中であり、以下の薬剤が処方された。

(処方) **ロキソプロフェン Na テープ 50 mg (7 × 10 cm 非温感) 28 枚**
1 日 1 回 右膝に 1 枚貼付

問 277 (薬剤) 本テープ剤に関する記述のうち、誤っているのはどれか。1 つ選べ。

- 1 室温で保存する。
- 2 製剤均一性試験法の適用を受ける。
- 3 溶出試験法の適用外である。
- 4 膏体は支持体に展延されている。
- 5 水を含む基剤を用いた貼付剤である。

正解 5

(第 100 回)

問 278-279 75 歳男性。血糖コントロール不良で入院した。眼底検査のために眼科を受診したところ、眼圧上昇が認められたので、以下の薬剤が処方された。

(処方)

チモプトール XE 点眼液 0.5% (注) (2.5 mL/本) 1 回 1 滴
1 日 1 回 両眼に点眼 全 1 本

(注：チモロールマレイン酸塩を 0.5% 含む持続性点眼液)

問 278 (実務)

ベッドサイドで今回の処方に対する服薬指導を行う前に、カルテ等から調べておく患者情報として、優先度の高いのはどれか。2 つ選べ。

- 1 HbA1c 値
- 2 低密度リポタンパク質コレステロール (LDL-C) 値
- 3 気管支ぜん息の既往歴
- 4 高尿酸血症の既往歴
- 5 心疾患の既往歴

正解 3, 5

問 279 (薬剤)

チモプトール XE 点眼液には、以下の添加物が用いられている。

添加物：ジュランガム、トリス (ヒドロキシメチル) アミノメタン、
ペンゾドデシニウム臭化物、D-マンニトール

この点眼剤が持続性を示す機構として、正しいのはどれか。1 つ選べ。

- 1 涙液中のナトリウムイオンと反応しゲル化するため。
- 2 薬物と添加物が不溶性の複合体を形成しているため。
- 3 薬物が徐放性微粒子に内封されているため。
- 4 薬物が o/w 型エマルジョンの油層に保持されているため。
- 5 高分子を結合させたプロドラッグであるため。

第98回

正解 1

9. ターゲティング

- ① ターゲティングの概要と意義
- ② 代表的なドラッグキャリアー、そのメカニズム

11. その他のDDS

- ① 代表的な生体膜透過促進法
- ② 代表的な組換え医薬品

問 178 ターゲティングに関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 受動的ターゲティングとは、標的部位を特異的に認識できる抗体や糖タンパク質などを薬物に結合させて体内分布を制御する方法である。
- 2 逆ターゲティングとは、副作用を発現する部位への薬物分布を回避する手法である。
- 3 リポソームは、内部の疎水性コアに薬物を含有させた高分子ミセル製剤である。
- 4 昇圧化学療法とは、抗がん薬をマイクロカプセルなどのキャリアーに封入して、腫瘍の栄養動脈に注入する治療法である。
- 5 標的細胞内で特異的に発現する酵素により親薬物に変換されるプロドラッグを用いることで、薬物の標的細胞への選択的作用が得られる。

正解 2, 5

第99回

問 178 DDS 製剤とその目的について、正しいものの組合せはどれか。

	DDS 製剤	目的
a	硝酸イソソルビドの経皮吸収型製剤	主薬の吸収促進
b	ポリエチレングリコールで化学修飾したインターフェロンの注射剤	主薬の作用時間延長
c	アムホテリシン B の注射用リポソーム製剤	病巣部位への移行性の向上
d	デキサメタゾンパルミチン酸エステルを含有させたりピッドマイクロスフェア製剤	腫瘍組織への指向性の向上
1	(a, b)	2 (a, c) 3 (a, d)
4	(b, c)	5 (b, d) 6 (c, d) 第93回

正解 4

問 179 局所作用を目的とした製剤はどれか。2つ選べ。

- 1 ブプレノルフィン塩酸塩坐剤
- 2 バンコマイシン塩酸塩散
- 3 デスマプレシン酢酸塩水和物点鼻液
- 4 ブデソニド吸入液
- 5 ツロブテロール貼付剤

第99回

正解 2, 4

問 180 リポソームに関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 大豆油とレシチンで調製される閉鎖小胞であり、静脈内投与後、発症部位へ選択的に移行する薬物運搬体として利用される。
- 2 脂質二重膜からなる閉鎖小胞であり、水溶性及び脂溶性いずれの薬物も含有することができる。
- 3 通例、直径数 μm ～数百 μm の大きさで、薬物を芯物質としてこれを高分子物質で被覆したものであり、薬物の安定化や放出制御に利用される。
- 4 ポリエチレングリコールで表面を修飾することで、血中滞留性が向上する。

正解 2、4

第98回

問179 リポソームに関する記述の正誤について、正しい組合せはどれか。

- a 油相として大豆油を用い、レシチンを乳化剤に用いて乳化した o/w 型エマルジョンに分類される。
- b 脂溶性、水溶性いずれの薬物に対してもキャリアーとして利用できる。
- c 静脈内投与した場合には、肝臓や脾臓等の細網内皮系組織で貪食される。
- d 血中滞留性の向上を目的として、ポリエチレングリコールによる表面修飾が利用される。

	a	b	c	d
1	正	正	誤	誤
2	正	誤	正	誤
3	正	誤	誤	正
4	誤	正	正	正
5	誤	正	正	誤
6	誤	誤	誤	正

正解 4

第94回

問 55 脂質二分子膜から成る微粒子はどれか。1つ選べ。

- 1 リビッドマイクロソフェア
- 2 リポソーム
- 3 高分子ミセル
- 4 デンドリマー
- 5 シクロデキストリン

第97回

正解 2

問 100 脂質の二分子膜に関する記述のうち、正しいのはどれか。1つ選べ。

- 1 両親媒性脂質の親水基どうしが向かい合わせとなった分子膜である。
- 2 温度が高くなると、脂質分子の回転・拡散の運動性が高まる。
- 3 不飽和脂肪酸鎖の二重結合が通常トランス型をとり、運動性を増大させる。
- 4 リポソームは、球状ミセル集合体である。
- 5 ゲル状態の二分子膜にコレステロールを加えると、膜の流動性が低下する。

正解 2

第97回

問 166 薬物吸収に関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 鼻粘膜は、全身作用を目的としたペプチド性薬物の投与部位として利用されている。
- 2 吸入されたステロイドは、その大部分が全身性循環血に吸収され治療効果を示す。
- 3 ニトログリセリンの経皮吸収型製剤は、胸の近傍に貼付しなければならない。
- 4 ウイテプゾールを基剤とする坐剤は、体温で基剤が融解し主薬が吸収される。

正解 1、4

第97回

問 167 単純拡散による薬物の生体膜透過に関する記述のうち、正しいのはどれか。1つ選べ。

- 1 イオン形薬物は、非イオン形薬物と比べて透過性が高い。
- 2 脂溶性薬物は、水溶性薬物と比べて透過性が高い。
- 3 高分子薬物は、低分子薬物と比べて透過性が高い。
- 4 透過速度は Michaelis-Menten 式で表される。
- 5 構造類似薬物の共存により、透過速度が低下する。

正解 2

第97回

問 283 (薬剤) ペグインターフェロンアルファ-2b は、インターフェロンアルファ-2b にメトキシポリエチレングリコールを結合させたものである。この結合の目的として、誤っているのはどれか。1つ選べ。

- 1 水溶性の向上
- 2 抗原性の低下
- 3 タンパク質分解酵素に対する安定性の向上
- 4 肝臓への標的指向化
- 5 糸球体ろ過の抑制

正解 4

第99回

10. プロドラッグ

① 代表的なプロドラッグ、そのメカニズムと有用性

問 284-285 70 歳男性、マイコプラズマ肺炎の治療のため、以下の薬剤が処方された。

(処方)

エリスロシンドライシロップ 10% (注1) 1回 2 g (1日 8 g) [製剤量]

ビオフェルミン R 散 (注2) 1回 0.75 g (1日 3 g) [製剤量]

1日 4回 朝昼夕食後、就寝前 14 日分

(注1：一般名は、エリスロマイシンエチルコハク酸エステル)

(注2：耐性乳酸菌製剤)

問 284 (実務) 両薬剤をそれぞれ秤量した後、分包する方法として、最も適切なのはどれか。1つ選べ。

- 1 乳鉢と乳棒を用いて混和し、分包する。
- 2 乳鉢とスパテルを用いて混和し、分包する。
- 3 混和せずに 2 段分割 (2 度撒き) で分包する。
- 4 混和せずに別々に分包する。

正解 4

問 285 (薬剤) エリスロシンドライシロップはプロドラッグ製剤である。この場合のプロドラッグ化の目的として、正しいのはどれか。1つ選べ。

- 1 胃内での溶解性の向上
- 2 胃内での分解の抑制
- 3 小腸粘膜透過性の改善
- 4 肝初回通過効果の回避
- 5 細菌内への取り込みの促進

第97回

正解 2

問 49 フルオロウラシルのプロドラッグはどれか。1つ選べ。

- | | | |
|------------|-------------|----------|
| 1 ドキシフルリジン | 2 エノシタビン | 3 シスプラチン |
| 4 イリノテカン | 5 シクロホスファミド | |

第97回

正解 1

問178 プロドラッグとプロドラッグ化の目的の対応のうち、正しいものの組合せはどれか。

- | プロドラッグ | | 目的 |
|--------|---------------|---------------|
| a | バカンピシリン塩酸塩 | 受動拡散の促進 |
| b | バラシクロビル塩酸塩 | 標的細胞内での選択的活性化 |
| c | テモカプリル塩酸塩 | トランスポーターの利用 |
| d | インドメタシンファルネシル | 受動拡散の促進 |
| e | ドキシフルリジン | 標的細胞内での選択的活性化 |
- 1 (a, b) 2 (a, e) 3 (b, c)
 4 (c, d) 5 (d, e)

第96回

正解 2

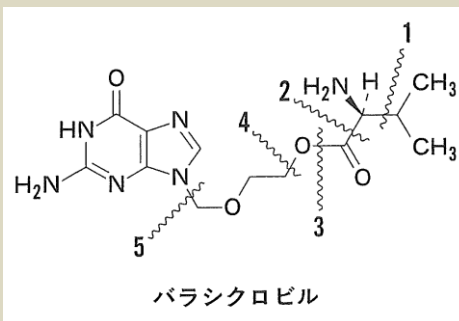
問 55 消化管障害の軽減を目的としたプロドラッグはどれか。1つ選べ。

- 1 テモカプリル塩酸塩
- 2 ヒドロコルチゾンコハク酸エステルナトリウム
- 3 アセメタシン
- 4 カンデサルタンシレキセチル
- 5 エリスロマイシンステアリン酸塩

第99回

正解 3

問 209 パラシクロビルは、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。



正解 3

第99回

問 282-283 75歳男性。2日前から腹部に痛みを伴う赤い発疹が認められた。この発疹は小さな水ぶくれとなり帯状に広がり、激しい痛みとなった。近医を受診し、帯状方疱疹と診断され、病院に入院となり、以下の薬剤が処方された。

(処方1) **パラシクロピル錠** 500 mg 1回2錠(1日6錠)
1日3回 朝昼夕食後 7日分

(処方2) **ナプロキセン錠** 100 mg 1回1錠(1日3錠)
1日3回 朝昼夕食後 7日分

問 283 (薬剤) アシクロビルのプロドラッグであるバラシクロピルに関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1 アシクロビルにエチレングリコールを結合させた化合物で、体内吸収後の血中滞留性はアシクロビルより優れている。
- 2 主に肝臓のエステラーゼで加水分解されてアシクロピルに変換される。
- 3 経口投与後のアシクロビルとしてのバイオアベイラビリティは、消化管からの吸収率が高まるため、アシクロビル経口投与時のそれより高くなる。
- 4 経口投与後のアシクロビルとしてのバイオアベイラビリティは、肝臓での代謝を回避できるため、アシクロビル経口投与時のそれより高くなる

正解 2、3

(第100回)

表 8.2 プロドラッグの実例

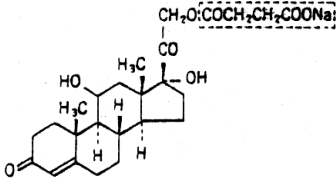
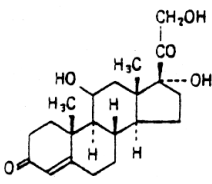
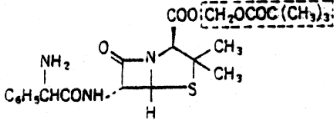
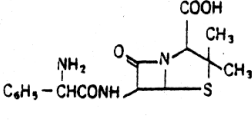
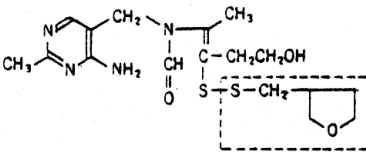
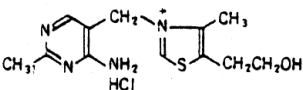
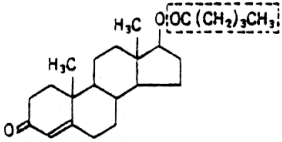
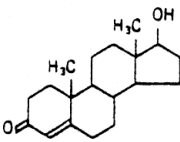
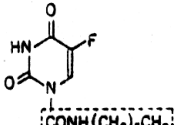
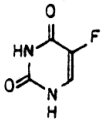
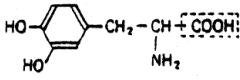
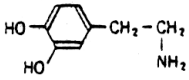

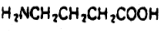
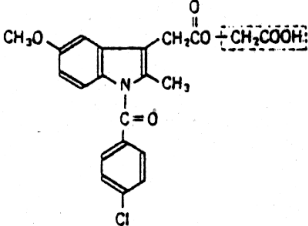
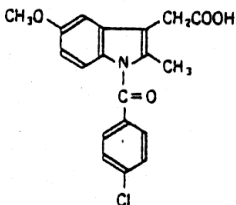
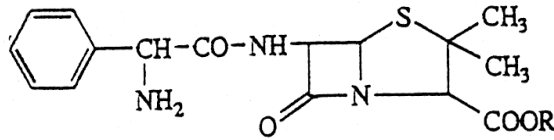
プロドラッグ	親化合物	プロドラッグ化の様式	復元の機構	復元の目的
 <p>Hydrocortisone 21-sodium succinate</p>	 <p>Hydrocortisone</p>	<p>カルボン酸 エステル化 (コハク酸)</p>	<p>エステラーゼによる加水分解</p>	<p>水溶性付与による注射剤化</p>
 <p>Pivampicillin</p>	 <p>Ampicillin</p>	<p>アミノロキシ メチル化</p>	<p>エステラーゼによる加水分解とホルマリンの自然脱離</p>	<p>脂溶性の付与 (吸収性改善)</p>
 <p>Fulsultiamine</p>	 <p>Tiamine HCl</p>	<p>開環/ ジスルフィド結合</p>	<p>グルタチオンとの交換反応 グルタチオンレダクターゼ</p>	<p>脂溶性の付与 (吸収性改善と作用の持続化)</p>
 <p>Testosterone enanthate</p>	 <p>Testosterone</p>	<p>カルボン酸 エステル化</p>	<p>エステラーゼによる加水分解</p>	<p>難水溶性による作用の持続化</p>
 <p>Carmofur</p>	 <p>5-Fluorouracil</p>	<p>カルバモイル化</p>	<p>化学的加水分解</p>	<p>持続的復元による作用の持続化</p>
 <p>Levodopa</p>	 <p>Dopamine</p>	<p>カルボン酸の付加</p>	<p>デカルボキシラーゼ</p>	<p>一種のアミノ酸にすることによる吸収性の改善 分布の改善</p>
 <p>2-Pyrrolidinone</p>	 <p>γ-Aminobutyric acid</p>	<p>開環</p>	<p>酵素的</p>	<p>脂溶性の付与 (分布の改善)</p>
 <p>Acemethacin</p>	 <p>Indomethacin</p>	<p>グリコール酸 エステル化</p>	<p>エステラーゼによる加水分解</p>	<p>活性のマスクによる消化管に対する副作用の軽減</p>

表 アンピシリンプロドラッグの経口投与後の生物学的利用能の比較
 (Stella, V. J., Mikkelson, T. J. & Pipkin, J. D. (1986)
 in Drug Delivery Systems (Juriano, R. L., ed.) pp.112
 -176, Oxford University Press, New York より引用)

	解析方法	生物学的利用能
I Ampicillin		1.0
II Pivampicillin	尿中排泄量 (0~6 hr)	2.68
	AUC (0~6 hr)	3.13
III Bacampicillin	尿中排泄量 (0~6 hr)	1.43
	AUC (0~6 hr)	1.67
IV Talampicillin	尿中排泄量 (0~6 hr)	1.70
	AUC (0~6 hr)	1.87

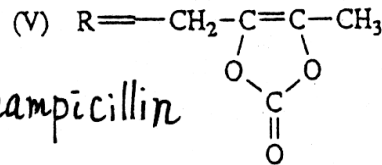
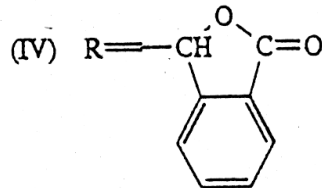
表中の生物学的利用能は ampicillin の投与後の値を1として換算したもの



(I) R=H

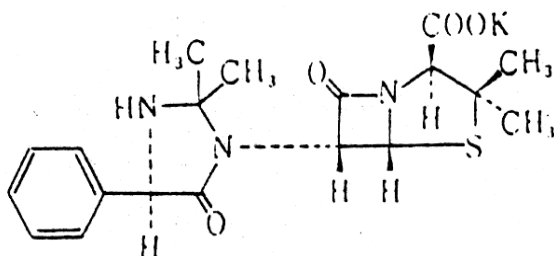
(II) R=CH₂-OOC-C(CH₃)₃

(III) R=CH(CH₃)-O-C(=O)-O-C₂H₅

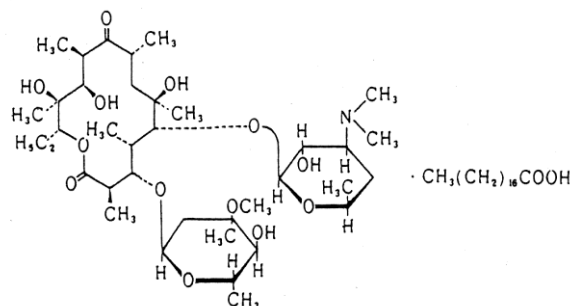


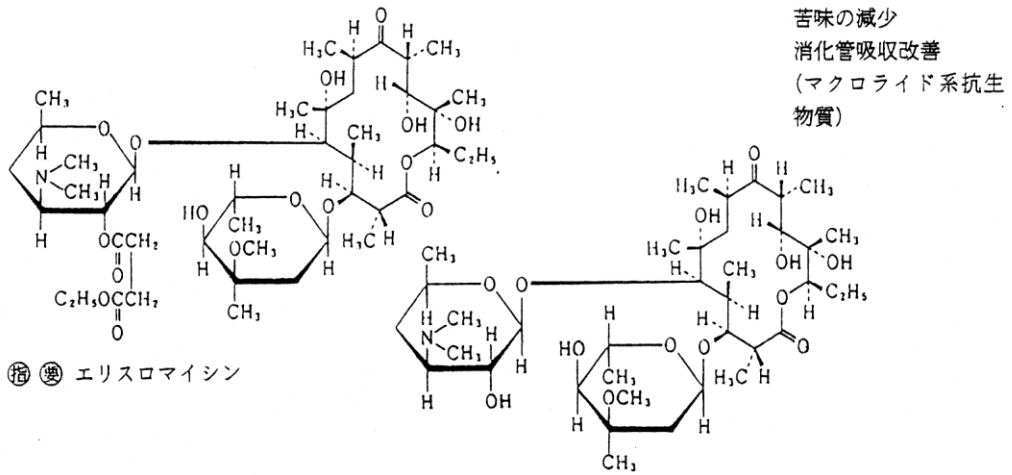
Lenampicillin

⑩ ⑤ ヘタシリンカリウム

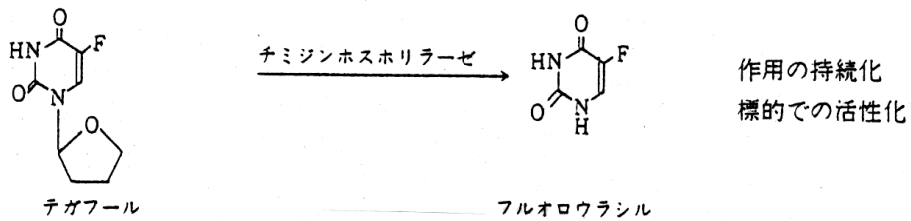
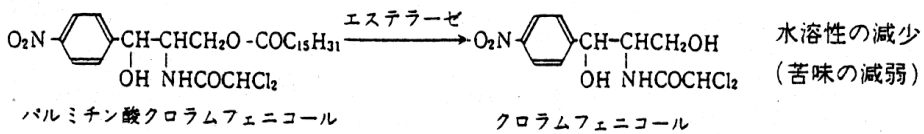
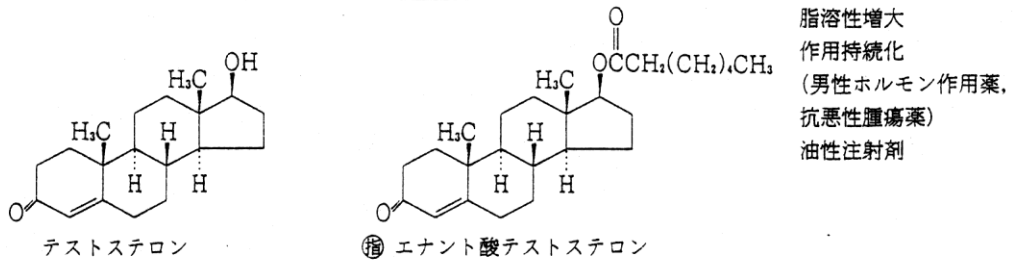


⑩ ⑤ ステアリン酸エリスロマイシン

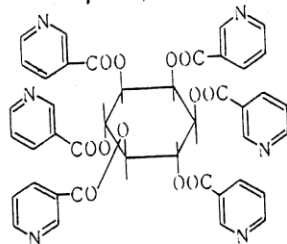




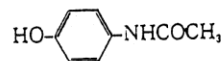
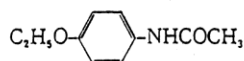
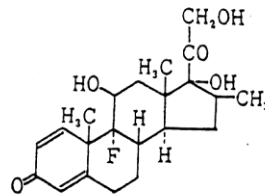
⑩ ⑪ エチルコハク酸エリスロマイシン




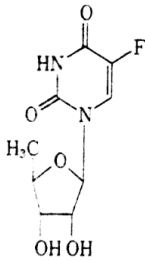
イノシトールニコチナート
血中エステルでゆっくり分解



⑩ ⑪ ベタメタゾン



<p>ドキシフルリジン </p> <p>doxifluridine</p> <p>▶フルツロン Furtulon (日本ロシュ)</p> <p>—カプセル：100 mg, 200 mg 添加物：ラウリル硫酸ナトリウム</p>	<p>〔効〕 胃癌，結腸・直腸癌，乳癌。</p> <p>〔用〕 ④ 1日800～1200 mgを3～4回で分服。</p>	<p>〔禁〕 重篤な本剤過敏歴。</p> <p>〔慎〕 骨髄機能抑制，心疾患とその既往歴，感染症合併，肝・腎障害，水痘，小児。</p> <p>〔副〕 白血球減少，貧血，血小板減少，GOT・GPT・Al-P・ビリルビン上昇，血尿，蛋白尿，BUN上昇，下痢，悪心・嘔吐，食欲不振，口内炎，腹痛，倦怠感，ふらつき，色素沈着，かゆみ，発疹，脱毛，発熱，心電図異常（ST上昇），咽頭異和感。</p> <p>〔妊〕 動物で催奇形作用→有益時のみ投与。</p>
--	--	---

<p>作用機序</p> <p>体内動態</p>	<p>腫瘍細胞で活性の高い酵素ピリミジンヌクレオシドホスホリラーゼによって5-FUに変換され，抗腫瘍効果をあらわす。従って，最終的作用機序は5-FUと同じである。</p> <p>C_{max}：1.0～2.3 $\mu\text{g}/\text{ml}$， T_{max}：1～2 hr (800 mg p. o.) 5-FUとして C_{max}：0.08～0.24 $\mu\text{g}/\text{ml}$， T_{max}：1～2 hr (800 mg p. o.) 血漿たん白結合率： 14.6～40.8% 尿中排泄率：14.8% (p. o., 12 hr) 主な代謝物：5-デオキシリボース-1-リン酸，5-FU</p>	<div style="text-align: center;">  </div> <p>mw：246.20 mp：約191° (分解) ★白色の結晶性の粉末で，においはない。 $[\alpha]_{D}^{20}$：+157～+171° (水) pKa：7.57 ★やや溶けやすい。 油水分配係数：0.042 (n-オクタノール/pH 7.4)</p>
---------------------------------------	--	---

イ. アスピリンアルミニウム——副作用の軽減

アスピリンは食欲不振，悪心，上腹痛などの胃腸障害を生じることが知られている。アスピリンアルミニウムとすることで酸性環境下での分解を抑えて胃障害の軽減を図った。

ロ. ベンジルペニシリンプロカイン (第13局非収載) ——薬効の持続化

主に注射薬として用いられたベンジルペニシリンの吸収および排泄は速く，投与後約3時間ほどでほとんどが排泄されてしまう。注射回数の削減や体内持続時間の延長を目的として工夫され，水に難溶性のプロカイン塩が懸濁水性および油性注射剤として製剤化された。

ハ. ステアリン酸エリスロマイシン——安定化

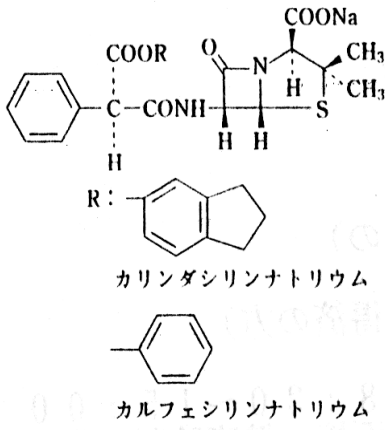
エリスロマイシンは胃内の酸性環境下で加水分解を受けやすく，酸性溶液に溶解しにくいステアリン酸エリスロマイシンとしてプロドラッグ化されることによりそのバイオアベイラビリティの向上が図られた。ステアリン酸エリスロマイシンは小腸においてエリスロマイシンを遊離する。

ニ. パルミチン酸クロラムフェニコール (第13局非収載) ——苦味の軽減

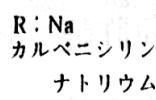
クロラムフェニコールは良く知られた抗生物質であるが，極めて苦く，小児用の製剤などには使用が困難である。苦みを軽減する目的で水に難溶性のパルミチン酸エステルが開発された。エステル自体は抗菌活性を示さないが，腸管壁，血中のエステラーゼにより分解され，クロラムフェニコールが遊離されて活性を示す。小児用としてはシロップ剤として使用される。

ホ. メチルテストステロン——安定化

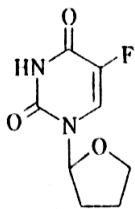
テストステロンは肝で代謝され易く経口投与では無効であり，一方，17 α 位がアルキル化されたメチルテストステロンは肝で代謝されにくく，経口投与で有効である。



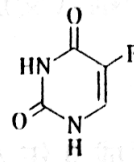
エステラーゼ



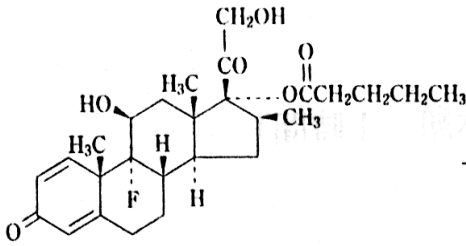
脂溶性の増加
(消化管吸収の改善)



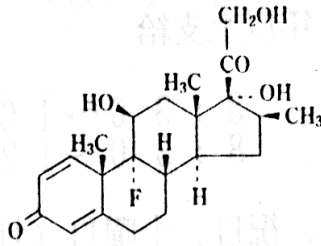
チミジンホスホリラーゼ



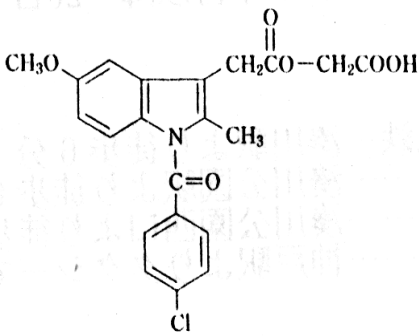
作用の持続化
標的での活性化



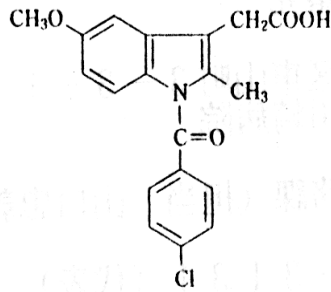
エステラーゼ



経皮吸収性の増大



エステラーゼ



副作用(胃腸障害)の減弱