

『薬剤学（第2版）』9章の章末問題解答例

1. ターゲティング達成のための方法とその具体的例について説明せよ。

解答例：

方法	具体的例
局所投与	動脈内注入，化学塞栓療法
標的部位の生体反応の利用	プロドラッグ，昇圧化学療法
薬物キャリアーの利用	分子性キャリアー（ポリエチレングリコール） 微粒子性キャリアー（リポソーム，リピッドマイクロスフェア） 生物由来キャリアー（分子標的薬）

2. 脂質二分子膜からなる微粒子はどれか。

- ア．リピッドマイクロスフェア
- イ．リポソーム
- ウ．高分子ミセル
- エ．ポリエチレングリコール
- オ．シクロデキストリン

（解答）イ

3. ターゲティングを利用した DDS に関して，正しい記述はどれか。

- a．プロスタグランジン E₁ 誘導体を含む脂肪乳剤は，動脈硬化病変部や炎症部に集積する性質がある。
- b．酢酸リユープロレリンを含む乳酸・グリコール酸共重合体マイクロカプセルは，皮下に投与すると長期にわたって酢酸リユープロレリンを放出し，性ホルモン分泌を抑制する。
- c．ネオカルチノスタチンをスチレン・無水マレイン酸交互共重合体に結合させた化合物は，ネオカルチノスタチンの分子量と水溶性を高めた高分子化医薬である。

- d. ドキソルビシンの注射用リポソーム製剤ドキシル[®]は、リポソームはポリエチレングリコールでコーティングされている。
- e. 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は、主薬の作用時間延長を目的としたものである。

解答例：a,b,d,e

c: ネオカルチノスタチンをスチレン・無水マレイン酸交互共重合体に結合させた化合物は、ネオカルチノスタチンの分子量と疎水性を高めた高分子化医薬である。

4. 代表的な分子標的薬をあげて、その作用機序を説明せよ。

ゲフィチニブ：がん細胞の異常増殖のシグナル伝達において重要な役割を果たしている上皮成長因子受容体（epidermal growth factor receptor, EGFR）の細胞内領域（チロシンキナーゼ領域）において、ゲフィチニブは ATP 結合部位に競合的に結合し、その後のシグナル伝達を遮断する。

セツキシマブ、パニツムマブ：セツキシマブおよびパニツムマブは、EGFR の細胞外領域（リガンド結合）に結合し、リガンド（EGF）の EGFR への結合を妨害することによって、チロシンキナーゼの二量体化を阻害する抗体薬である。

イマチニブ：イマチニブは、慢性骨髄性白血病の原因となる染色体転座により生じた BCR-ABL チロシンキナーゼを阻害する。

ベバシズマブ：ベバシズマブは、血管内皮増殖因子（vascular endothelial growth factor, VEGF）と特異的に結合し、血管内皮細胞の VEGF 受容体に対する VEGF の結合を阻害する。