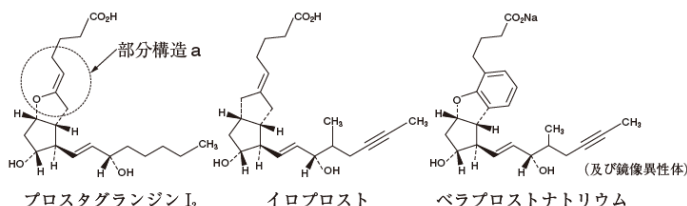


105-212

問題文



1. イロプロストはプロスタグランジンI₂の部分構造aの酸素原子を炭素原子に置換することにより、シトクロムP450による代謝を受けやすくしている。
2. ベラプロストナトリウムはプロスタグランジンI₂のプロドラッグである。
3. ベラプロストナトリウムはカルボン酸部位を塩とすることにより、水溶性を向上させている。
4. プロスタグランジンI₂の部分構造aの二重結合の立体化学はE配置である。
5. ベラプロストナトリウムはプロスタグランジンI₂の部分構造aに芳香環を導入することにより、酸性条件下での安定性を向上させている。

解答

問212 : 1, 3問213 : 3, 5

解説

問212

選択肢 1 は妥当な記述です。

頻度は少ないのですが、血管拡張によるほてりや頭痛の副作用がまれに起きることが知られています。

選択肢 2 ですが

ベラプロストは、プロスタサイクリン受容体を刺激し、アデニル酸シクラーゼを活性化することで細胞内cAMP濃度上昇をもたらし、血管拡張作用、血小板凝集抑制作用などを示す薬です。血を「固まりやすく」する作用ではありません。よって、選択肢 2 は誤りです。 ()

選択肢 3 は妥当な記述です。

徐放錠なので、噛んだりすると徐放性が失われます。

選択肢 4 ですが

妊婦や妊娠可能性のある人には投与禁忌です。よって、選択肢 4 は誤りです。

以上より、正解は 1,3 です。

問213

選択肢 1 ですが

フラン環が飽和炭素五員環になったからといって、CYPの代謝を受けやすくなるのではないだろうと感じるのではないのでしょうか。選択肢 1 は誤りと考えられます。

選択肢 2 ですが

構造を比較すると、余計なメチル基がついていたりするので、「代謝されてプロスタグランジンI₂になる」化合物ではないと判断できるのではないのでしょうか。選択肢 2 は誤りと考えられます。

選択肢 3 は妥当な記述です。

カルボン酸→塩 で水溶性向上というのは納得できる構造変換と考えられます。

選択肢 4 ですが

二重結合に対し、優先度が高い方が「同じ側」とわかります。つまり「Z」配置です。よって、選択肢 4 は誤りです。

選択肢 5 は妥当な記述です。

以上より、正解は 3,5 です。