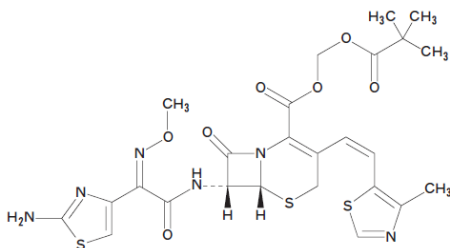


102-210

問題文



セフジトレン ピボキシル

1. ペネム骨格を有している。
2. β -ラクタム環のカルボニル基の炭素の求電子性は、一般的な鎖状アミドのカルボニル基の炭素に比べて低くなっている。
3. 細菌中のペプチドグリカン合成酵素との間で、 β -ラクタム環の開環を伴って共有結合を形成することにより、細胞壁の生合成を阻害する。
4. セフジトレンのカルボキシ基を構造修飾することにより、経口吸収性が改善されたプロドラッグである。
5. 生体内での加水分解反応によって、セフジトレン、酢酸及びピバル酸(2,2-dimethylpropanoic acid)を生じる。

解答

問210 : 1, 2問211 : 3, 4

解説

問210

選択肢 1,2 は正しい選択肢です。

選択肢 3 ですが

3歳未満で下痢がよくある副作用で、症状に応じ対症療法等適切な処置の必要があります。放置してよいわけではありません。

選択肢 4 ですが

尿が赤くなる代表的な小児に用いられる薬は、セフゾンやアスピリンなどです。この薬剤についての説明としては不適切であると考えられます。よって、選択肢 4 は誤りです。

選択肢 5 ですが

わずかに苦味がある薬です。バニラアイスクリーム等が味をうまくマスクしてくれることが知られています。

以上より、正解は 1,2 です。

問211

商品名は、メイアクトです。

選択肢 1 ですが

中央の β -ラクタム環に注目します。「ペネム骨格」は、右側が5員環です。本問の構造は右側が6員環です。ペネム骨格ではありません。これは、セフェム系です。

選択肢 2 ですが

一般的アミドは反応性が極めて乏しいですが、 β -ラクタム環の $C=O$ の炭素は環のひずみがあることから求核攻撃を受けやすいです。すなわち、求電子性が高くなっています。

選択肢 3,4 は、正しい選択肢です。

選択肢 5 ですが

ピボシキル基（構造の右上部分）が、エステラーゼにより加水分解を受け、ピバル酸とホルムアルデヒドに分解します。酢酸では、ありません。

以上より、正解は 3,4 です。

※補足。少し細かいので、国試では不要。

ピボシキル基の付加によりプロドラッグ化して経口吸収を可能にしているのですが、ピボシキル基の加水分解により生じるピバル酸により、低カルニチン血症 → 低血糖 となることがごくまれにあることが報告されています。

従って、抗生物質にはいくつかピボシキル基を有するものがあるのですが共通して気をつけるべき副作用として頭の片隅に入れておくといわれます。※補足 終わり。