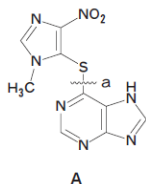


101-106

問題文

プロドラッグAに関する記述のうち、正しいのはどれか。2つ選べ。



1. プリン環をもつ。
2. 確認試験では、希塩酸中亜鉛粉末で還元し、芳香族第一アミン(芳香族第一級アミン)の定性反応を利用できる。
3. 生体内でエステラーゼによって加水分解されて薬効を示す。
4. 生体内において、aの位置で切断されて薬効を示す。
5. 代謝された後、主にシトシンリボヌクレオチドの生合成を阻害する。

解答

1, 2

解説

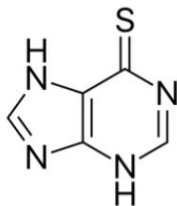
プロドラッグ A はアザチオプリンです。(これは、構造からわかる必要はありません。) 6-MP (メルカプトプリン) のプロドラッグです。

選択肢 1 はその通りの記述です。
右下の部分です。

選択肢 2 は、正しい記述です。
亜鉛で還元してアミンの定性反応を利用することから、これは、官能基 NO₂ の確認試験です。左上の部分のイミダゾール環部分は芳香環なので、還元後に芳香族第一級アミンとなります。

選択肢 3 ですが
エステラーゼで加水分解されるのであれば、エステル結合、すなわち R-COO-R' があるはずですが。プロドラッグ A に、そのような部分は見当たりません。よって、選択肢 3 は誤りです。

選択肢 4 ですが
A は、プロドラッグで、体内で代謝されて 6-MP になります。構造は、以下の通りです。



従って、S の下ではなく S の上の方で切断されると考えられます。よって、選択肢 4 は誤りです。実際の試験では「6-MP の構造がプリンで、S ついてたなあ・・・」 → 「S を含んで切断されるはず」と考えることができると思います。(できれば選択肢 1,2 で正しいと判断したい問題という印象です。)

選択肢 5 ですが

プリン塩基は、アデニンとグアニンです。よって「シトシン」ヌクレオチドの合成ではなく、アデニンやグアニンヌクレオチドの合成を阻害すると考えられます。従って、選択肢 5 は誤りです。

以上より、正解は 1,2 です。