105-106

問題文

Ser Ser
$$CH_3$$
 Glu
 His
 H_3C
 CH_3
 Glu
 His
 H_3C
 CH_3
 Glu
 His
 H_3C
 CH_3
 Glu
 His
 H_3C
 CH_3
 CH_3

- AChE 阻害剤 A AChE 阻害剤 B
- 1. グルタミン酸-ヒスチジンの相互作用により、ヒスチジンのイミダゾリル基の塩基性が高くなる。
- グルタミン酸ーヒスチジンーセリンの三つのアミノ酸残基間の相互作用によって、セリンのヒドロキシ基の求電子性が高くなる。
- 3. アセチルコリンはトリプトファンとイオン結合している。
- 4. AChE阻害剤Aはセリンのヒドロキシ基を不可逆的にアミド化する。
- 5. AChE阴害剤Bはセリンのヒドロキシ基を不可逆的にリン酸化する。

解答

1, 5

解説

選択肢1は妥当な記述です。

イミダゾリル基の塩基性が高まります。グルタミン酸側に 負電荷を有する O があるため、「イミダゾリル基の NH の H が抜ける方向の相互作用」と考えると判断できると思われます。H が抜ける方向なので、N の孤立電子対が顕わになるような相互作用であるため、塩基性が高くなるということです。

選択肢 2 ですが

セリンの OH 基の O が、右側では トリプトファンの C=O 基に「求核攻撃」しているため「求核性」が高くなっていると考えられます。よって、選択肢 2 は誤りです。

選択肢 3 ですが

阻害薬が「セリン残基を修飾」して作用する という点から「トリプトファン と イオン結合」ではないと 判断するとよいと思われます。選択肢 3 は誤りです。

選択肢 4 ですが

阻害剤 A は「ネオスチグミン臭化物」です。これは読み取れる必要があります。すると「可逆的阻害薬」なので「不可逆的に」ではありません。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 1.5 です。

類題