102-106

問題文

次に示した医薬品の活性成分Aに関する記述のうち正しいのはどれか。2つ選べ。

- 1. N末端のアミノ酸はD-プロリンである。
- 2. C末端では、L-プロリンの環内の窒素がN-エチル化されている。
- 3. L-ロイシンのエナンチオマーであるD-ロイシンが含まれている。
- 4. 経口投与には適さない。

解答

3, 4

解説

1について、ペプチドを構成するアミノ酸を並べて表記する場合、左側をN末端に、右側をC末端にするのが一般的です。よって、今回はN末端なので左端に注目します。この環状アミノ酸がD-プロリンかどうかということですが、これは正しくはL-ピログルタミン酸です。

ピログルタミン酸という化合物の構造や名称を覚える必要は特にありませんが、タンパク質を構成する20種類のアミノ酸については覚えておくべきなので、そのうちのひとつであるプロリンの構造は抑えておいてください。プロリンの構造は以下の通りです。

$$L-\overline{\mathcal{I}}$$
 $D-\overline{\mathcal{I}}$ $D-\overline{\mathcal{I}}$ $D-\overline{\mathcal{I}}$

よって、これは誤りの記述です。

2で、1の解説にも書いた通り、ペプチドの並びは左側がN(アミノ基)、右側がC(カルボキシル基)です。つまり、Pro(プロリン)の窒素は左側のArg(アルギニン)との結合に使われているため、「プロリンの環内の窒素がN-エチル化」という部分は誤りです。

よって、L-プロリンの環内の窒素がN-エチル化しているのではなく、カルボキシル基の炭素にエチルアミノ基 $(-NHCH_2CH_3)$ が結合しています(Pミド化)。

3に関して、問題文に記載されている活性成分Aを見ると、「D-Leu」が含まれていますが、「Leu」はロイシン(Leucine)のことなので、これは正しい記述です。

4について、この問題の医薬品に限らず、ペプチド医薬品は胃や腸の消化酵素によって分解されてしまうので、一般的には経口投与ができません。たとえば糖尿病の治療で用いるインスリン注射も同様の理由で経口投与ではなく注射としています。よって、これは正しい記述です。

よって、正解は3と4です。