103-132

問題文

以下に構造を示す2-アセチルアミノフルオレンの代謝と発がんに関する記述のうち、正しいのはどれか。1つ 選べ。

- 1. 2-アセチルアミノフルオレンはCYP3A4によりN-水酸化体に代謝される。
- 2. N-水酸化体はアセチル化されて解毒される。
- 3. N-水酸化体のアセチル化反応において、窒素原子にアセチル基が付加する。
- 4. N-水酸化体は硫酸抱合を介して代謝的活性化を受け、ニトレニウムイオンが生成する。
- 5. N-水酸化体から生じるメチルカチオンが、DNAに共有結合することにより、発がんに関わる。

解答

4

解説

アセチルアミノフルオレンは、 芳香族アミンの発がん性などの 陽性対照物質として用いられます。 N-水酸化されたのち、 硫酸抱合をうけて活性化されます。

選択肢 1 ですが

CYP 3A4 ではありません。 CYP 3A4 で代謝される 発がん性物質といえば アフラトキシン B₁ です。3 A4 により、エポキシ化されます。 よって、選択肢 1 は誤りです。

選択肢 2 ですが

アセチル化されて代謝活性化されます。 解毒されるわけではありません。 よって、選択肢 2 は誤りです。

選択肢3ですが

N-OH→N-O-COCH $_3$ となります。 すなわち、酸素原子にアセチル基が付加します。 よって、選択肢 $_3$ は誤りです。

選択肢 4 は、正しい記述です。

選択肢 5 ですが

メチルカチオンが DNA を化学修飾するのは ジメチルニトロソアミンです。 よって、選択肢 5 は誤りです。

以上より、正解は4です。

類題