

医薬品化学

《担当者名》准教授 / 山田 康司

【概要】

医薬品は標的となる生体分子との特異的な相互作用により薬理効果を発現する。しばしば鍵と鍵穴の関係に例えられるこの機構を学ぶうえで、鍵の形状すなわち医薬品の基本骨格や官能基を熟知している必要がある。薬理系科目と医薬品化学I、IIでの知識を基礎に、医薬品の化学構造を主軸として薬理作用、薬物代謝、副作用との関連について有機化学の視点から理解、説明できることを目的とする。

【学修目標】

医薬品と標的となる生体分子との様々な相互作用を説明できる。
 医薬品に含まれる複素環、特徴的な共通構造とその性質について説明できる。
 医薬品の構造に基づく作用機序を説明できる。
 代表的な酵素阻害薬の構造と特徴を説明できる。
 代表的な抗炎症薬の構造と特徴を説明できる。
 代表的な抗菌薬の構造と特性を説明できる。
 代表的な核酸塩基類似医薬品の構造と特性を説明できる。
 代表的なスルホンアミド系抗菌薬の構造と特性を説明できる。

【学修内容】

回	テーマ	授業内容および学修課題	担当者
1	酵素の基質構造を模倣した化合物（基質アナログ）による競合阻害 - 1 「臨床医薬品化学」p25, 162-165, 172-173, 199-208 「パートナー薬理学」p156-158, 378-382	酵素（アセチルコリンエステラーゼ、シクロオキシゲナーゼ、アンギオテンシン変換酵素）阻害薬の構造を説明できる。 酵素阻害薬の作用機序を酵素反応に基づいて説明できる。 関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(2)- -2	山田 康司
2	酵素の基質構造を模倣した化合物（基質アナログ）による競合阻害 - 2 「臨床医薬品化学」p10, 50, 54-55, 228-231 「パートナー薬理学」p486-488, 490-491, 505-506	酵素（核酸系代謝酵素、ジヒドロ葉酸レダクターゼ、5-還元酵素）阻害薬の構造を説明できる。 酵素阻害薬の作用機序を酵素反応に基づいて説明できる。 関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(2)- -2	山田 康司
3	抗菌薬の構造と特徴 「臨床医薬品化学」p219-228 「パートナー薬理学」p462-486	抗菌薬（キノロン系、ニューキノロン系、β-ラクタム系）の構造を説明できる。 抗菌薬の作用機序を説明できる。 酵素阻害薬の作用機序を酵素反応に基づいて説明できる。 関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(2)- -2, C4-(3)- -2, E2-(2)- -1,2, E2-(2)- -1	山田 康司
4	ヌクレオシドおよび核酸塩基を有する医薬品 「臨床医薬品化学」p. 37, 228-234, 240 「パートナー薬理学」p342-344, 436-438, 486-492, 507-509	医薬品となる核酸塩基アナログを列挙して説明できる。 核酸塩基アナログの標的分子と作用を説明できる。 関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(3)- -1, E2-(7)- -1, E2-(7)- -1	山田 康司

回	テーマ	授業内容および学修課題	担当者
5	DNAと結合する医薬品 DNAにインターカレートする医薬品 DNAを切断する医薬品 「臨床医薬品化学」p. 48-71 「パートナー薬理学」p499-505, 508-513	DNAと共有結合する医薬品の構造と特徴を説明できる。 アルキル化剤の作用部位、機序を説明できる。 インターカレターの構造と作用機序を説明できる。 DNA切断分子の構造と作用機序を説明できる。 病原微生物・悪性新生物が関わる疾患に用いられる代表的な薬物の基本構造と薬効(薬理・薬物動態)の関連を概説できる。 関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(3)- -1,2,3、E2-(7)- -1、E2-(7)- -1	山田 康司
6	酵素と基質の反応遷移状態を模倣した阻害薬 - 1 「臨床医薬品化学」p37, 176, 182-183, 189-190, 231 「パートナー薬理学」p213-216, 398-399, 491-492	酵素(アデノシンデアミナーゼ、イノシン5'-リン酸デヒドロゲナーゼ、HIVプロテアーゼ、レニン)の反応遷移状態阻害薬の構造を説明できる。 酵素反応遷移状態阻害薬の作用機序を酵素反応に基づいて説明できる。 関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(2)- -3	山田 康司
7	酵素と基質の反応遷移状態を模倣した阻害薬 - 2 「臨床医薬品化学」p91, 234-239, 248-251 「パートナー薬理学」p426-427, 429-434, 489-491	酵素(ノイラミニダーゼ、-グルコシダーゼ、HMG-CoAレダクターゼ)の反応遷移状態阻害薬の構造を説明できる。 酵素反応遷移状態阻害薬の作用機序を酵素反応に基づいて説明できる。 関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(2)- -3	山田 康司
8	スルホンアミド構造を有する医薬品 「臨床医薬品化学」p. 89-90, 180-183, 227 「パートナー薬理学」p233-234, 351-354, 385-386, 421-423, 479-480,	スルホンアミド系抗菌薬の構造と作用機序を説明できる。 スルホンアミド構造を有する利尿薬と糖尿病治療薬を説明できる。 関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(3)- -3、E2-(3)- -1、E2-(3)- -1、E2-(7)- -1	山田 康司

【授業実施形態】

面接授業

授業実施形態は、各学部(研究科)、学環、学校の授業実施方針による

【評価方法】

期末定期試験(筆記)100%により評価する。

試験終了後、試験問題の解説を遠隔授業ポータルサイト(Google drive)で公表する。

【教科書】

「現場で役に立つ! 臨床医薬品化学」臨床医薬品化学研究会 編 化学同人

「パートナー薬理学」石井邦雄・栗原順一・田中芳夫 編 南江堂

【参考書】

「スタンダード薬学シリーズ 3 化学系薬学 生体分子・医薬品の化学による理解」日本薬学会 編 東京化学同人

「医薬品構造化学」前川智弘 著 京都廣川書店

【学修の準備】

予習: 第3学年前後期の薬理系科目と第3学年後期の生体分子の化学の関連する範囲を事前に復習しておくこと(50分)。

復習: 教科書、プリント、講義メモを活用し、毎講義開始時に行うショートテスト(評価対象外)に備える(50分)。

【関連するモデルコアカリキュラムの到達目標】

C1 物質の物理的性質

(1) 物質の構造【 化学結合】-1~3【 分子間相互作用】-1~7

C3 化学物質の性質と反応

(2) 有機化合物の基本骨格の構造と反応【 芳香族化合物】-4,5

(3) 官能基の性質と反応【 アルコール・フェノール・エーテル】-1【 電子効果】-1【 酸性度・塩基性度】-1,2

C4 生体分子・医薬品の化学による理解

(3) 医薬品の化学構造と性質、作用【 医薬品と生体分子の相互作用】-1【 医薬品の化学構造に基づく性質】-1,2【 医薬品のコンポーネント】-1~3【 酵素に作用する医薬品の構造と性質】-1~6【 受容体に作用する医薬品の構造と性質】-1~5【 DNAに作用する医薬品の構造と性質】-1~3【 イオンチャネルに作用する医薬品の構造と性質】-1 E2 薬理・病態・薬物治療

(1) 神経系の疾患【 自律神経に作用する薬】-1,2【 中枢神経系の疾患の薬、病態、治療】-1,2【 化学構造と薬効】-1 (

2) 免疫・炎症・アレルギーおよび骨・関節の疾患と薬【 抗炎症薬】-1,2【 化学構造と薬効】-1 (3) 循環器系・血液系・造血管系・泌尿器系・生殖器系の疾患と薬【 利尿薬】-1【 化学構造と薬効】-1

(4) 呼吸器系・消化器系の疾患と薬【 化学構造と薬効】-1

(5) 代謝系・内分泌系の疾患と薬【 内分泌疾患の薬、病態、治療】-1【 化学構造と薬効】-1

(6) 感覚器・皮膚の疾患と薬【 化学構造と薬効】-1

(7) 病原微生物(感染症)・悪性新生物(がん)と薬【 抗菌薬】-1【 悪性腫瘍の薬、病態、治療】-1【 化学構造と薬効】

-1

E4 薬の生体内運命

(1) 薬物の体内動態【 代謝】-4

【薬学部ディプロマ・ポリシー(学位授与方針)との関連】

2. 有効で安全な薬物療法の実践、ならびに人々の健康な生活に寄与するために必要な、基礎から応用までの薬学的知識を修得している。

【その他】

この科目は主要授業科目に設定している