

《担当者名》講師 / 坪郷 哲

【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。第3学年の薬理系科目と生体分子の化学での知識を基礎に、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。

【全体目的】

医薬品は作用によって構造特性が異なり、その違いを見極められることが化学的視点から医薬品を取り扱う薬剤師の長所となる。医薬品の化学構造（基本骨格、官能基、化学修飾など）から反応性や物性を読み解き、薬理作用との関連を有機化学の視点から説明できる基礎知識を養う。

【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。  
 代表的な神経系作用薬の構造と特徴を説明できる。  
 ステロイドおよびペプチド関連医薬品の構造と特性を説明できる。  
 代表的な抗菌薬と核酸塩基類似医薬品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	医薬品と標的分子となる生体分子に働く相互作用  「医薬品構造化学」p. 1-10	医薬品と標的分子との間に働く相互作用を説明できる。 共有結合、イオン結合、水素結合、イオン-双極子相互作用、ファンデルワールス力および疎水性相互作用について具体例を挙げて説明できる。  関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C1-(1)- -1~7、C4-(3)- -1	坪郷 哲
2	医薬品の構造に基づく性質 プロドラッグとその変換機構  「医薬品構造化学」p. 14-17, 27-38	医薬品の構造から酸性・塩基性、親水性・疎水性などの物理化学的性質を説明できる。 酸・塩基および疎水性・親水性を決定する官能基、要因を説明できる。 プロドラッグの目的、効果と構造様式を説明できる。 プロドラッグから活性体への構造変化を説明できる。  関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C1-(3)- -1,2、C4-(3)- -1,2、E4-(1)- -4	坪郷 哲
3	医薬品の特徴的な構成要素（ファーマコフォア） 医薬品に含まれる生物学的等価体（バイオアイソスター）  「医薬品構造化学」p. 19-25	代表的な官能基を列挙し、性質を説明できる。 官能基が及ぼす電子効果について概説できる。 医薬品の作用に必要な構成要素を説明できる。 受容体に作用する内因性リガンドと医薬品の共通構造を説明できる。 生物学的等価体となる官能基の例を説明できる。  関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C1-(3)- -1、C1-(3)- -1、C4-(3)- -1,2	坪郷 哲
4	医薬品に含まれる複素環  「医薬品構造化学」p. 38-41	代表的な芳香族複素環化合物の性質を芳香族性と関連づけて説明できる。 代表的な芳香族複素環化合物の求電子置換反応の反応性、配向性、置換基の効果について説明できる。	坪郷 哲

回	テーマ	授業内容および学修課題	担当者
		<p>複素環を構造、性質により分類、説明できる。 複素環と標的分子との相互作用を説明できる。</p> <p>関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C1-(2)- -4,5、C4-(3)- -3</p>	
5	<p>ヌクレオシドおよび核酸塩基を有する医薬品</p> <p>「医薬品構造化学」p. 41-43, 241-248, 297-306,</p>	<p>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。</p> <p>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</p>	坪郷 哲
6	<p>抗炎症薬の構造と特徴</p> <p>「医薬品構造化学」p. 125-137</p>	<p>抗炎症薬の標的分子を説明できる。 抗炎症薬の共通構造（フェニル酢酸、フェニルプロピオン酸、サリチル酸、インドール酢酸など）を説明できる。</p> <p>関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(3)- -2、E2-(2)- -1,2、E2-(2)- -1</p>	坪郷 哲
7	<p>スルホンアミド構造を有する医薬品</p> <p>「医薬品構造化学」p. 204-209, 214-216, 249-259</p>	<p>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。</p> <p>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</p>	坪郷 哲
8	<p>キノロン骨格をもつ医薬品 -ラクタム構造を有する医薬品</p> <p>「医薬品構造化学」p. 259-270, 278-281</p>	<p>抗菌薬（キノロン系、ニューキノロン系、-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。</p> <p>関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(3)- -4,5、E2-(7)- -1、E2-(7)- -1</p>	坪郷 哲
9	<p>医薬品としてのペプチドアナログ ステロイドホルモンとステロイド骨格をもつ医薬品</p> <p>「医薬品構造化学」p. 139-154, 193-201, 306-308</p>	<p>医薬品として用いられるペプチドホルモンとペプチドアナログを説明できる。 ペプチドをリードとして開発された医薬品を説明できる。 ステロイドホルモンの構造と分類を説明できる。 ステロイドホルモン関連医薬品を分類、説明できる。</p> <p>関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(3)- -6、C4-(3)- -3、E2-(2)- -1,2、E2-(2)- -1、E2-(5)- -1、E2-(5)- -1</p>	坪郷 哲
10	<p>カテコールアミン構造を有する医薬品 アセチルコリンアナログとしての医薬品</p> <p>「医薬品構造化学」p. 155-173, 175-191</p>	<p>アドレナリン受容体アンタゴニストの構造と特徴を説明できる。 ニコチン性およびムスカリン性受容体アゴニストの構造と特徴を説明できる。 ニコチン性およびムスカリン性受容体アンタゴニストの構造と特徴を説明できる。</p> <p>関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(3)- -1,2、E2-(1)- -1,2、E2-(1)- -1</p>	坪郷 哲
11	<p>ベンゾジアゼピン骨格およびバルピタール骨格を有する医薬品</p> <p>「医薬品構造化学」p. 55-69</p>	<p>ベンゾジアゼピン骨格を有する医薬品の構造と作用を説明できる。 バルピタール骨格を有する医薬品の構造と作用を説明できる。</p> <p>関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(3)- -4、E2-(1)- -1、E2-(1)- -1</p>	坪郷 哲

回	テーマ	授業内容および学修課題	担当者
12	オピオイドアナログとしての医薬品 イオンチャンネルに作用する医薬品  「医薬品構造化学」p. 71-80, 202-204	オピオイドアナログの構造と特徴を説明できる。 Ca <sup>2+</sup> 、Na <sup>+</sup> 、K <sup>+</sup> の各イオンチャンネルに作用する医薬品を分類し、特徴を説明できる。  関連するモデルコアカリキュラムの到達目標 C4-(3)- -5、C4-(3)- -1、E2-(1)- -2、E2-(1)- -1	坪郷 哲
13	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  「医薬品構造化学」p. 315-340	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	坪郷 哲

#### 【授業実施形態】

面接授業

授業実施形態は、各学部（研究科）、学校の授業実施方針による

#### 【評価方法】

期末定期試験（100％）

#### 【教科書】

「医薬品構造化学」前川智弘 著 京都廣川書店

#### 【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  
「化学構造と薬理作用」 柴崎正勝・赤池昭紀・橋田 充 編集 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（80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（80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【 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【 酸性度・塩基性度】-1,2

(3) 官能基の性質と反応【 概説】-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【 イオンチャン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・造血器系・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。