

| 薬品合成化学B<br>(Synthetic Organic Chemistry B) |        |      |       |     | 担当教員                                         |
|--------------------------------------------|--------|------|-------|-----|----------------------------------------------|
|                                            |        |      |       |     | 教授 山下 正行<br>講師 小島 直人<br>助教 岩崎 宏樹<br>助教 服部 恭尚 |
| 科目群                                        | 開講期    | 授業形態 | 単位数   | 必修等 |                                              |
| 薬学専門教育(講義)                                 | 3年次 後期 | 講義   | 1.5単位 | 必修  |                                              |

#### [概要]

前半では、薬品合成化学Aに引き続き、ターゲット分子を合成するための種々の反応、複素環化学について学ぶ。後半では、日本薬局方に収載されている医薬品の化学構造に基づく物理・化学的性質を利用する確認試験法について学ぶ。また、これまでの有機化学系関連授業で学習してきた反応がどのように医薬品の合成に利用されているか学ぶ。

#### [授業の一般目標]

ターゲット分子を合成するための位置および立体選択的な骨格構築、保護基の利用、光学活性化合物の合成法、複素環化合物の性質、反応性、合成法について学ぶ。

日本薬局方の確認試験は、医薬品の構造や分解物を化学的に処理することにより発色、においやガスの発生、沈殿の有無などを確認する化学的方法と機器分析による物理的方法がある。医薬品の合成はもとより、医薬品の分解や発色、においやガスの発生、沈殿の有無を今までに学んできた有機化学や無機化学の知識に基づいて理解する。

#### [準備学習(予習・復習)]

有機化学A～D及び薬品合成化学Aで学習した内容が基礎になるので、よく理解しておくこと。

予習：授業でどのようなことを学ぶか知るために、その範囲に目を通してから授業に出席すること。

復習：単に暗記するのではなく、反応機構などを考えながら復習すること。立体的な構造を考えるために分子模型は役立つ。分子模型を組み立て、見ながら勉強する癖をつけること（面倒臭いは禁句）。日本薬局方収載の医薬品は約1750品目である。一品目ごとの確認試験を覚えることはほぼ不可能である。一つ一つを暗記するのではなく、一つ一つの操作が何を行っているのかを構造と結び付けて理解すること。

#### [学習項目・学生の到達目標と、対応するSBOコード]

| No | 学習項目                         | 担当教員 | 学生の到達目標                                      | SBOコード                    |
|----|------------------------------|------|----------------------------------------------|---------------------------|
| 1  | ターゲット分子の合成：官能基、位置および立体選択性（ ） | 小島   | 官能基選択性を理解し、説明できる。位置および立体選択性に関する用語を理解し、説明できる。 | C5-(1)-11<br>C5-(2)- -1,2 |
| 2  | ターゲット分子の合成：官能基、位置および立体選択性（ ） | 小島   | 位置および立体選択的反応を理解し、説明できる。                      | C5-(2)- -1,2              |
| 3  | ターゲット分子の合成：保護基（ ）            | 小島   | 官能基ごとの保護基を理解し、説明できる。                         | C5-(2)- -1                |
| 4  | ターゲット分子の合成：保護基（ ）            | 小島   | 官能基ごとの保護基を理解し、説明できる。                         | C5-(2)- -1                |
| 5  | ターゲット分子の合成：光学活性化合物           | 小島   | 光学活性化合物を得るための手法を理解し、説明できる。                   | C5-(2)- -1                |
| 6  | 医薬品に含まれる複素環（ ）               | 服部   | 複素環化合物を指摘し、分類できる。芳香族複素環の性質を芳香族性と関連付けて説明できる。  | C6-(2)- -1-3              |
| 7  | 医薬品に含まれる複素環（ ）               | 服部   | 代表的な芳香族複素環化合物の反応性、配向性について説明できる。              | C6-(2)- -4,5              |
| 8  | 医薬品に含まれる複素環（ ）               | 服部   | 代表的な芳香族複素環化合物の反応性、配向性について説明できる。              | C6-(2)- -4,5              |
| 9  | 医薬品の確認試験（ ）                  | 山下   | 日本薬局方収載医薬品の確認試験について説明できる。                    | C2-(2)- -2                |
| 10 | 医薬品の確認試験（ ）                  | 山下   | 日本薬局方収載医薬品の確認試験について説明できる。                    | C2-(2)- -2                |
| 11 | 医薬品の確認試験（ ）                  | 山下   | 日本薬局方収載医薬品の確認試験について説明できる。                    | C2-(2)- -2                |
| 12 | 医薬品の確認試験（ ）                  | 小島   | 日本薬局方収載医薬品の確認試験について説明できる。                    | C2-(2)- -2                |
| 13 | 医薬品の確認試験（ ）                  | 小島   | 日本薬局方収載医薬品の確認試験について説明できる。                    | C2-(2)- -2                |
| 14 | 医薬品の合成                       | 岩崎   | 医薬品の合成について説明できる。                             | C5-(2)- -1                |

|    |        |  |  |
|----|--------|--|--|
| 15 | 総括・まとめ |  |  |
|----|--------|--|--|

|     | (書名)                                                                               | (著者・編者)                                              | (発行所)                       |
|-----|------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------|-----------------------------|
| 教科書 | 有機医薬品合成化学 - ターゲット分子の合成 -<br>プリント配布                                                 | 西出、前崎                                                | 廣川書店                        |
| 参考書 | 第十六改正日本薬局方解説書<br>パートナー 薬品製造学（改訂第二版）<br>ソロモンの新有機化学（上・下）<br>化学構造と薬理作用 - 医薬品を化学的に読む - | 日本薬局方解説書編集委員会<br>野上、田口、長<br>池田、上西、奥山、花房<br>西出、佐々木、栄田 | 廣川書店<br>南江堂<br>廣川書店<br>廣川書店 |

#### 【成績評価方法・基準】

定期試験の結果を主として評価する。課題提出を考慮する場合あり。

#### 【オフィスアワーなど担当教員に対する質問等の方法】

オフィスアワー：火・木の17:00～19:00；出張等でオフィスアワーを持ってないときもありますので、メール[創薬科学フロンティア研究センター 2 階 - 山下: yamasita@mb.kyoto-phu.ac.jp, 小島: kojima@mb.kyoto-phu.ac.jp, 岩崎: iwasaki@mb.kyoto-phu.ac.jp, 3 階 - 服部: hattori@mb.kyoto-phu.ac.jp]で事前に問合せください。メールでの質問は受け付けません。