

科 目 名
<b>化学系薬学実習 (その2:医薬品化学)</b> <b>Laboratory Work in Medicinal Chemistry</b>

4年 前期 2単位 必修

原野 一誠・吉武 康之  
山口 幸輝

## 概要・目標

既に学んだ医薬品化学の知識をもとに、実際の医薬品合成を行う。

化学系薬学実習(その1:有機化学)で得た基本操作技術を生かし、更なるスキルの向上と、合成反応の理解を深めることを目標とする。

## 授業計画

### (1-3) 協奏的環化付加反応

Tetracyclone, maleanilic acid, N-phenylmaleimideの合成: 活性メチレンとカルボニルの反応、アシル化、イミド形成

Cyclopentadienone環化付加体の合成: Diels-Alder 反応、立体選択性

### (4) Grignard 試薬の調製及び Grignard 反応

Phenylmagnesium bromide, benzoic acid の合成: 無水反応、有機金属化合物

### (5、6) Fischer の indole 合成

Acetophenone phenylhydrazone, 2-Phenylindole の合成: ヒドラゾン形成反応、3,3-Simagatorpy 転位

### (7、8) 医薬品合成反応

Acetanilide, p-acetamidobenzenesulfonyl chloride, p-acetamidobenzenesulfonamide, sulfanilamide の合成: アシル化、クロロスルホン化、アミド形成、加水分解

### (9、10) 確認試験

芳香族第一アミン呈色反応、インドール呈色反応 (Ehrlich 反応)

## 評価方法

出席、実習態度、レポート、筆記試験等を総合的に判断し評価する。

## 教 材

テキスト: 実習書を配布

参考書: 有機化学実験のてびき [1] -物質取扱法と分離精製法 (化学同人)、新版 続 実験を安全に行うために (化学同人)、ブルース有機化学上・下 (化学同人)、化学系薬学IIスタンダード薬学シリーズ3 (東京化学同人)

## コアカリキュラムとの関連

ターゲット分子の合成: 官能基の導入変換 <C5(1)-7~12>、複雑な化合物の合成: 炭素骨格の構築法 <C5(2)-1-1~4>、位置及び立体選択性 <C5(2)-2-1,2>、保護基 <C5(2)-3-1>、総合演習 <C5(2)-5-1~3>

## 履修上の注意

実習は体験型の学習である。内容を理解せずに実習に挑むことは無意味である。必ずその日の実習内容を予習してくること。英文は和訳をしてフローチャートを作成することが望ましい。取扱いを誤ると危険な薬品もあるので、実験には細心の注意をはらって挑むこと。保護メガネの着用なき者は入室できない。

## 他の講義との関連

化学系薬学実習その1: 有機化学 (2年後期) → 医薬品化学 (3年前期) → 医薬品合成化学 (3年後期) → 本科目

本実習では、反応がうまく進行しなかった場合、その原因説明と再実験の計画を学生に委ねる、自己研鑽・参加型学習を行う。