

# 明日の有機合成化学

主 催:有機合成化学協会関西支部 共 催:近畿化学協会・日本化学会近畿支部・日本農芸化学会関西支部・日本薬学会近畿支部

日 時：平成23年9月5日(月)～6日(火)

会 場：大阪科学技術センター 8F 大ホール (大阪市西区靱本町1-8-4 電話06-6443-5324)  
〔交通〕地下鉄四つ橋線「本町駅」25番・28番出口を北へ約5分(うつぼ公園北詰)

【9月5日】

## 1.「経口骨粗鬆症治療薬を指向したピラゾロピリミジン系カルシウム感受性受容体拮抗薬の創薬研究(TAK-075の創製)」(10:00～11:00)

武田薬品工業(株) 医薬研究本部炎症疾患創薬ユニット 主任研究員 吉田 雅都 氏

骨粗しょう症では、鬆(す)が入ったように骨の中がスカスカの状態になり、骨がもろくなる。癌や脳卒中のようにそれ自身が生命をおびやかす病気ではないが、骨粗しょう症による骨折から寝たきりとなり、要介護状態になる人は少なくない。本発表では新規経口骨粗鬆症治療薬を指向したカルシウム感受性受容体拮抗薬 TAK-075 の創製について述べる予定である。

## 2.「合成化学・物質科学・生命科学を指向した元素化学研究」(11:00～12:00)

東京大学大学院薬学系研究科 教授/理化学研究所基幹研究所 チームリーダー 内山 真伸 氏

元素化学の発展によって、今や周期表のあらゆる金属元素・有機金属化合物の利用が可能となりつつある。有機合成が純粋有機化学の時代から有機金属化学を取り入れたことで大きく発展した事実を鑑みれば、生物研究・材料研究にも有機金属化合物が有効なツールとなる可能性は大きい。当研究室では、周期表横断型の元素化学を基軸に、合成化学・分光学・理論化学を基盤として『高度分子変換化学』『未踏物質科学』『未知生命科学』に挑んでおりそのいくつかの例を紹介する。

## 3.「有機イオン対の構造制御に基づく触媒機能の創出と応用」(13:20～14:20)

名古屋大学大学院工学研究科 教授 大井 貴史 氏

第四級オニウム塩は、有機カチオンとの相互作用を介して、反応性アニオン種をそのままの形で制御できる「有機イオン対触媒」としての可能性をもっている。本講演では、光学活性な第四級オニウム塩を独自に設計・合成し、適切な構造修飾によって多様な触媒機能を引き出すとともに、それを活かした新しい炭素－炭素及び炭素－ヘテロ結合形成反応を開拓しようという一連の研究展開について、最近の成果もあわせて紹介する。

## 4.「バソプレシン V2 アンタゴニストの合成研究」(14:20～15:20)

大塚製薬(株) Qs’研究所 合成室長 小川 英則 氏

バソプレシン受容体は7回膜貫通型のGPCRに分類され、生体内リガンドであるバソプレシンは9個のアミノ酸からなるペプチドである。バソプレシン受容体のうちV2受容体は腎臓からの水の再吸収を制御していることから、選択的V2アンタゴニストは従来使用されている塩類排泄型利尿剤と異なる「水利尿剤」となる。今回、このV2アンタゴニストの合成研究について報告する。

## 5.「ポスト・クロスカップリング時代の炭素－炭素結合形成反応」(15:40～16:40)

中央大学研究開発機構 教授 檜山爲次郎 氏

クロスカップリング反応は求核置換が困難なsp<sup>2</sup>炭素での置換を可能にし、π電子共役系の構築に大きな貢献をした。しかし、予め金属やハロゲンを導入して官能基化しておく必要があるうえ使用済金属廃棄の問題が浮上する。これに対し、通常は安定なC-C結合やC-H結合を活性化して原子効率100%すなわち廃棄物を伴わずに新たなC-C結合を形成する実用的新手法が望まれている。われわれの最新の成果を紹介する。

ミキサー (17:00～19:00) 参加無料 (於：7F レストラン)

【9月6日】

## 6.「レドックスシステムにより創製した有機活性種を用いる合成化学」(10:00～11:00)

岡山大学大学院自然科学研究科 教授 菅 誠治 氏

本講演では、有機電子移動反応、とくに電気化学的な酸化反応により発生させた高活性なカチオン性の有機活性種を用いた分子変換法について論じたい。とくに、反応性に富むN-アシルイミニウムイオンを用いた立体選択的なアルカロイドの合成を話題の中心に据える予定である。

## 7.「新規統合失調症治療薬ルラシドンの創製」(11:00～12:00)

大日本住友製薬(株)化学研究所 主任研究員 丸山 潤美 氏

既存の統合失調症治療薬には薬効不足や副作用が伴うケースが多く、治療満足度が高いとは言い難い。ルラシドンは、昨年10月米国にて承認された新規統合失調症治療薬である。構造活性相関研究により各受容体の結合様式を制御し、強力な薬効(陽性症状・陰性症状・認知障害)と副作用の軽減(錐体外路系障害・肥満・QTc延長)を実現した。本講演では本剤の研究開発経緯とその特徴について紹介したい。

## 8.「化学実験室における危機管理:M9.0 巨大地震からの教訓(東日本大震災に関する依頼講演)」(13:00～13:20)

東北大学大学院薬学研究科 教授 岩淵 好治 氏

阪神淡路大震災からわずか16年、我が国はまたも、その歴史に深く刻まれる大震災を経験しました。東北・太平洋岸地区では、確率99%(30年以内)と算定されたM8級大地震に備えを重ねてきました。しかし、想定を超えたエネルギーは、我々の防衛線を軽々と破り、新たな教訓を残しました。地震大国・日本において、最先端の化学研究を維持・発展させるために必要なことは何か、皆様とともに考えてみたいと思います。

## 9.「高選択的酸化プロセスの開発を機軸とした天然物合成研究」(13:20～14:20)

東北大学大学院薬学研究科 教授 岩淵 好治 氏

有機合成化学の発展に力を得て、優れた医薬品が創製されてきた。このことと同調して、医薬候補物質の構造は複雑化しつづけている。有機小分子の「複雑」性は、その酸化修飾度の高さに映し出される。創薬化学の発展のためには高効率・高選択的な酸化プロセスの開発が切望される。本講演では、天然物合成を試金石として、当研究室で開発された幾つかの高選択的酸化プロセスについて紹介したい。

## 10.「膜タンパク質との相互作用解明を志向した梯子状ポリエーテルの合成研究」(14:20～15:20)

九州大学大学院理学研究院 教授 大石 徹 氏

イオンチャンネルやプロトンポンプなどの膜タンパク質に作用して、強力な生理活性を示す天然有機化合物が見出されているが、分子レベルでの活性発現機構は謎に包まれている。本セミナーでは、梯子状ポリエーテル天然物に焦点を当て、分子プローブの設計・合成や活性評価など有機合成化学を基盤とした機能解明へのアプローチについて紹介する。

## 11.「触媒的不斉合成を鍵段階とする生物活性天然物の合成」(15:35～16:35)

千葉大学大学院薬学研究院 教授 濱田 康正 氏

本講演では我々が行ってきた二つの研究を紹介する。一つは遷移金属触媒に用いる新規不斉リン配位子の開拓である。通常5価のリンは配位子として用いられないが、例外的に反応系内で3価に互変異性化し、不斉配位子として機能するものを見出した。これを用いる不斉合成と天然有機化合物合成への応用を話す。もう一つはアンチ選択的不斉水素化反応を用いるアミノ酸の新規合成法とこれを用いる生物活性環状デブシペプチドの合成研究を紹介する。

参 加 費：(両日共受講) 会員29,000円、大学・官公庁15,000円、会員外33,000円、シニア会員5,000円、学生5,000円  
(一日のみ受講) 会員20,000円、大学・官公庁10,000円、会員外22,000円、シニア会員3,000円、学生3,000円  
ミキサー参加無料

参加申込方法：下記申込書に必要事項をご記入の上、下記申込先にお申し込み下さい。

(同内容をメール本文に記載して、お送りいただいても結構です。)

- ① 1日のみの受講は受講日を明記下さい。
- ② 送金方法は、銀行振込(りそな銀行御堂筋支店 普通 No.0035401 社団法人有機合成化学協会関西支部)、郵便振替(00970-8-159429 社団法人有機合成化学協会関西支部)、現金書留のいずれかをご利用下さい。
- ③ 主催・共催団体の維持・特別会員の会社・工場よりお申し込みの場合は、会員価格でご参加いただけます。
- ④ 申込者には、参加証を送付します。(8月下旬)

申 込 締 切：8月17日(水) ただし定員150名になり次第締切ります。

申 込 先：550-0004 大阪市西区靱本町1-8-4(大阪科学技術センター6階) 有機合成化学協会関西支部  
(TEL;06-6441-5531、FAX;06-6443-6685、E-mail;info@soc-kansai.org)

## 有機合成夏期セミナー「明日の有機合成化学」参加申込書 (平成23年度)

氏名		所属学協会	
勤務先		部署名	
所在地	〒 TEL E-mail	FAX	
参加日	A.両日参加( ) B.9/5( )・9/6( )の1日参加		*ミキサー参加( )
送金内容	参加費_____円 銀行振込( )・郵便振替( )・現金書留( ) 月 日送金(予定)		

(コピー可)