

# 有機合成のニュートレンド 2015

主 催：有機合成化学協会関西支部

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

日 時：2015年2月3日(火)・4日(水) 10時より

場 所：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)  
〔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)

## 【2月3日(火)】

1. 高反応性分子を駆使した新規 $\pi$ 共役系分子の合成 (10:00-11:00)

関西学院大学理工学部 教授 羽村季之氏

$\pi$ 共役系有機化合物は物性科学・材料科学における重要な物質群であるが、これらを構成する芳香環・複素環化合物の合成には大きな制限がある。そのため、新しい物性や機能の宝庫である $\pi$ 共役系分子をナノ領域のレベルまで自在に合成できる新しい合成方法論の開拓が望まれている。本発表では、潜在的に高い反応性を内在する分子をコア分子とする、多様な $\pi$ 共役系分子を構築するための合成法の開発について述べる。

## 2. 日本発の核酸医薬創製に向けて (11:00-12:00)

大阪大学薬学研究科 附属創薬センター長/教授 小比賀 聡氏

低分子化合物は創薬の中心的役割を担っているが、近年では抗体医薬や核酸医薬等の新たな創薬手法に注目が集まっている。中でも核酸医薬は綿密に設計された人工核酸を用い、疾病の原因となる遺伝子の働きを抑制するもので、有機合成化学の果たす役割は極めて大きい。本発表では、核酸医薬に資する人工核酸の設計・合成を中心に我々の取り組みの一端を紹介したい。

## 3. エチレンを原料とする新規メタクリル酸メチル製造法の開発 (13:30-14:30)

三菱レイヨン(株)大竹研究所 触媒研究センター 主席研究員 二宮 航氏

メタクリル酸メチル(MMA)は、高い透明性と耐候性を有するアクリル樹脂に利用されている有用な化合物である。MMAは種々の原料から誘導することができ、これまでに幾つもの製造プロセスが工業化されている。2008年には、安価に入手可能なエチレンを原料とする競争力の高い新たな製造法(Alpha法)が工業化された。本講演では、Alpha法の特徴を既存の他の製造法との比較も交えて紹介するとともに、MMA製造技術の現状と展望についても述べる。

## 4. 天然物基盤分子による幹細胞およびがん細胞の制御をめざして (14:30-15:30)

千葉大学大学院薬学研究院 准教授 荒井 緑氏

天然物は現在も変わらず創薬リードの宝庫である。我々はタンパク質や細胞ベースのアッセイを用いて、神経幹細胞およびがん細胞の制御をめざし、重要シグナルモジュレーターを探索、創製している。構築したアッセイ法の紹介とともに、これまで単離した天然物や天然物基盤合成化合物について報告する。

## 5. キラルヘリセンオリゴマーの合成と非平衡熱力学的反応 (15:45-16:45)

東北大学大学院薬学研究科 教授 山口雅彦氏

外部刺激に応答して構造を変化する分子スイッチ機能を有する合成有機化合物に興味を持たれる。ヘリセンを連結したキラルなオリゴマーの合成と機能研究の過程で、可逆的に二重ラセンを形成する化合物を見出した。また、スルホンアミドおよびアミノメチレンで連結したオリゴマーでは希薄溶液中で分子レベルの熱的ヒステリシス、すなわち加熱と冷却で異なる反応経路を取る現象を示した。関連する非平衡熱力学的反応性について述べる。

ミキサー (17:00-19:00) 於：アリスロード (大阪市中央区瓦町4-5-9 井門瓦町ビルB1)

## 【2月4日(水)】

## 6. 膜タンパク質膜挿入の鍵を握る糖脂質 (10:00-11:00)

(公財)サントリー生命科学財団 主幹研究員 島本啓子氏

全ての生命は細胞膜上の膜タンパク質を介して、情報や物質のやりとりをしているため、膜タンパク質膜挿入の分子機構は、最も重要な生命活動のプログラムの一つである。最近我々は、大腸菌の内膜から膜挿入に必須の新しい因子MPIaseを同定した。驚いたことにMPIaseはタンパク質成分を含まない新規の糖脂質であった。この奇妙な糖脂質の構造と機能について述べる。

## 7. 有機ラジカル種の特異な性質を探る最近の研究 (11:00-12:00)

大阪大学大学院理学研究科 教授 久保孝史氏

有機ラジカル種は、その反応性の高さから、複雑な骨格を持つ分子の合成に用いられてきた。また、不対電子の特性を活かして、分子磁性体や分子性導電体など、機能性材料の構成要素としても重要な役割を果たしてきた。本講演では、そのような有機ラジカル種の新たな特性を探る最近の研究について紹介する。

## 8. Discovery of Dolutegravir Carbamoyl Pyridone HIV-1 Integrase Inhibitor (13:30-14:30)

塩野義製薬(株) コア疾患創薬研究所 感染症化学1

グループリーダー 川筋 孝氏

HIV インテグラーゼ阻害剤の探索研究により、高い抗ウイルス活性を示すカルバモイルピリドンシリーズを見出した。最適化の末に見出されたドルテグラビルは低用量で1日1回のみの服薬を可能にし、かつ、既存の薬剤が課題として残す耐性ウイルスにも高い有効性を示した。発表では阻害剤探索の過程で経験した様々なトピックを振り返りたい。

## 9. 遷移金属触媒を用いる直接的芳香族カップリングの新展開 (14:30-15:30)

大阪大学大学院工学研究科 教授 三浦雅博氏

医薬品や有機電子材料など様々な有機精密化学品の合成と関連して、芳香族化合物の高効率かつ選択的な誘導体化反応の開発は、近年ますます重要な研究課題となっている。周知のように、遷移金属触媒を用いるクロスカップリングは、芳香族環上における最も重要な結合形成反応の一つであるが、最近では炭素-水素結合の切断を経る直接的かつ原子効率の高い反応法の開発が急速に進んでいる。本講演では、我々の最近の取り組みについて述べる。

## 10. 全炭素不斉四級炭素の立体選択的構築、そして天然物合成への展開

：過去30年間に達成したいくつかの成果 (15:45-16:45)

慶應義塾大学名誉教授・京都薬科大学客員教授 只野金一氏

近年、全炭素不斉四級炭素 [all-carbon quaternary stereogenic (carbon) center]の、エナンチオもしくはジアステレオ選択的な構築に関する研究が、遷移金属錯体触媒や有機分子触媒等を用いて盛んに研究されている。一方、演者は1980年代より、クライゼン転位反応、分子内Diels-Alder反応、および糖質由来のテンプレートをキラル環境場とした二重アルキル化にて、全炭素不斉四級炭素の立体選択的構築に挑戦してきた。これらの研究成果と天然物合成への展開について、代表例のいくつかを講述する。

## 参加費:

(両日共受講) 会員 29,000 円、大学・官公庁 15,000 円、シニア会員 5,000 円、会員外 40,000 円、学生 5,000 円

(1日のみ受講) 会員 20,000 円、大学・官公庁 10,000 円、シニア会員 3,000 円、会員外 25,000 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お申し込み下さい。

1日目のみの受講は受講日を明記下さい。

送金方法は、現金書留、銀行振込(りそな銀行御堂筋支店 普通預金 No.0035401 公益社団法人有機合成化学協会関西支部)、郵便振替(00970-8-159429 公益社団法人有機合成化学協会関西支部)のいずれかをご利用下さい。

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。

申込者には、参加証を送付します。(1月中旬頃)

申込締切: 1月15日(木) ただし定員120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 ; seminar@soc-kansai.org)

## 有機合成2月セミナー「有機合成のニュートレンド 2015」参加申込書 (2015年度) (コピー可)

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. <u>2/3</u> ( ) ・ <u>2/4</u> ( ) 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) / 請求書(要・不要)			