

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30年 8月27日（月）～ 28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）
〔交通〕大阪メトロ（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）

【 8月27日 】

1. 「分子夾雑系でのタンパク質有機化学」 (10:00～11:00)

京都大学大学院工学研究科 教授 浜地 格 氏

タンパク質などの生体高分子は、細胞や組織のような様々な分子種が高濃度に存在する分子夾雑な環境で機能する。そのためタンパク質をその環境のまま有機化学することは、とても重要と考えられながら、同時に非常に困難でもある。本セミナーでは、生細胞や組織での標的タンパク質の有機化学的変換反応の開発とケミカルバイオロジー的な展開に関して、我々の例を中心に紹介する。

2. 「HIV-1 インテグラーゼ阻害剤ドルテグラビルの効率的合成法の開発」 (11:00～12:00)

塩野義製薬株式会社 CMC 研究本部製薬研究センター プロセス化学部門長 安酸 達郎 氏

ドルテグラビルは、抗 HIV(ヒト免疫不全ウイルス)感染症薬である。創薬段階での合成法は収率や反応条件の点で大量合成への適用は困難であったことから、スケールアップ可能な合成法開発をおこない、二つの合成法、すなわち酸化反応と気液反応を鍵反応とする合成法、およびより短工程かつ高収率で原子効率に優れた合成法を確立した。本セミナーでは合成法開発のコンセプトとその詳細について紹介する。

3. 「新しい分子の振舞いを理解する：触媒機能から生物活性まで」 (13:20～14:20)

名古屋大学トランスフォーメティブ生命分子研究所 教授 大井 貴史 氏

カチオンおよびアニオンは有機合成化学における基本的な活性種であり、結合形成に欠かせない。我々は、炭素とヘテロ原子を用いてこれらに望ましい形を与えることで、対イオンの反応性と選択性の触媒的な制御に基づく反応開発の可能性を大きく拡張できることを実証してきた。本講演では、この研究展開の詳細に加えて、ITbM で生物学の研究者と共同で取り組んできた研究の成果についても紹介したい。

4. 「ペプチド医薬品探索の革命」 (14:20～15:20)

東京大学大学院理学系研究科 教授 菅 裕明 氏

タンパク製剤に代わる次世代薬剤として、有機小分子薬剤なみの低い分子量をもつ第3の医薬品開発の期待が高まっている。菅らは、特異性が高く、生理活性の高い特殊ペプチドを迅速且つ確実に発見できる RaPID(Random peptide integrated discovery)システムを開発した。RaPID システムは、菅らが独自に開発した人工 RNA 酵素「フレキシザイム」と大腸菌再構築無細胞リボソーム翻訳系を組み合わせた FIT システムに、mRNA ディスプレイを組み合わせることで構築された。本システムは、mRNA を鋳型として、特殊ペプチドを自在かつ簡便に翻訳合成し、活性種を迅速にスクリーニングする技術である。この技術を駆使することで、特殊ペプチドのライブラリー化も極めて容易に達成でき、様々な疾患原因タンパク質に対する特殊ペプチドの薬剤探索が可能となった。本講演では、この技術開発に至った経緯、骨芽細胞に及ぼす特殊環状ペプチドの例等、将来ビジョンを含めた最近の進展を紹介する。

5. 「ケミカルバイオロジー研究のための新手法の開発」 (15:40～16:40)

理化学研究所 袖岡有機合成化学研究室 主任研究員 袖岡 幹子 氏

標的タンパク質の同定と生細胞イメージングは、生物活性物質の作用機序解明研究においてたいへん重要であり、我々の研究室ではそのための新しい化学的な手法の開発を進めてきた。今セミナーでは、その中から O-NBD 法、Alkyne-Tag Raman Imaging (ATRI)、Alkyne-Tag Raman Screening (ATRaS)について紹介したい。

ミキサー (16:50～18:30) 参加無料 (於：7F レストラン)

【 8月28日 】

6. 「半導体レジスト材料レジストモノマー®の開発 –シミュレーションの活用–」 (10:00～11:00)

株式会社ダイセル 研究開発本部コーポレート研究センター 上席技師 大野 充 氏

株式会社ダイセルでの半導体レジスト材料開発の特徴は、材料に求められる性能を、ベースポリマーの構造、さらには、その原料であるモノマーに遡って設計・開発できることにある。本講演では、計算化学、流体解析といったシミュレーション技術を活用し、レジスト用ポリマー(セルグラフィー®)に用いる(メタ)アクリル酸エステル系機能性モノマー(レジストモノマー®)を開発、工業化した事例を紹介する。

7. 「反芳香族ポルフィリンから探る新たな芳香族性」 (11:00～12:00)

名古屋大学大学院工学研究科 教授 忍久保 洋 氏

芳香族化合物は多彩な機能を持ち、有機化学におけるスター分子群である。その反面、反芳香族化合物は不安定であり、その物性も未解明であるため、マニアックな研究対象と思われてきた。我々は反芳香族ポルフィリンであるノルコロールの合成に成功し、反芳香族化合物独自の性質を明らかにしつつある。本講演では、発見の経緯や特異な反応性、そして反芳香族化合物から生みだされる新たな芳香族性について紹介する。

8. 「タキソール全合成への挑戦」 (13:20～14:20)

慶應義塾大学理工学部 教授 千田 憲孝 氏

抗ガン剤として利用されているタキソール(パクリタキセル)は6/8/6 縮環系に橋頭位オレフィンが存在する高度に歪んだ構造のジテルペノイドであり、多くの不斉中心ならびにオキセタン環を有するなど、有機合成化学上きわめて重要な合成ターゲットである。われわれはヨウ化サマリウムを用いる中員環構築を鍵反応としたタキソールの全合成に挑戦してきた。本講演では本合成研究のこれまでの経緯と成果について述べる。

9. 「亜鉛、コバルト、マンガン錯体触媒によるエステル交換反応およびアミドの C-N 結合切断反応」

(14:20～15:20)

大阪大学大学院基礎工学研究科 教授 真島 和志 氏

アミン存在下における水酸基選択的なアシル化反応は、有機化学の非常識であり、亜鉛四核クラスター錯体やアルコキシ架橋二核コバルト錯体などの卑金属多核カルボキシ錯体が優れた触媒となる。ごく最近、Mn 触媒系がアミド-エステル交換反応において高い触媒活性を示すことを見出した。Zn や Co に加え、Mn がアシル基変換反応の優れた触媒となることは、生体内のペプチド分解酵素に Zn, Co, Mn が含まれていることに対する化学的根拠である。

10. 「フローマイクロ光化学による効率的物質合成」 (15:40～16:40)

奈良先端科学技術大学院大学先端科学技術研究科 教授 垣内 喜代三 氏

フローマクロリアクターを用いた光反応がここ数年注目され、学術論文も急激に増加している。このフローマイクロ光化学では、バッチ型反応場と比べて光路長が短いため、Lambert-Beer 則に従い、効率良く光反応が進行し、目的の物質合成が簡便に行える。加えて二相交互流のようなフローモードも自在に制御でき、さらに効率的な物質合成も可能となってきた。本講演では、我々の研究例も含めフローマイクロ光化学を紹介する。

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 7,000 円、学生 7,000 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 5,000 円、学生 5,000 円
ミキサー参加無料

参加申込方法：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。

HP (<http://www.soc-kansai.org/event/2018/2018summer.html>) から web 登録も可能です。

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 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)、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月中旬)

申 込 締 切：8月 3日 (金) ただし定員 1 2 0 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) 公益社団法人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)

有機合成夏期セミナー「明日の有機合成化学」参加申込書 (平成30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. <u>8/27 ()</u> ・ <u>8/28 ()</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>

(コピー可)