

有機合成の新潮流 — 反応剤・反応・創薬 新たな挑戦 —

主催 有機合成化学協会／共催 日本化学会、日本薬学会、日本農芸化学会

有機合成化学においては、新たな構造や機能を有する分子・目標とする分子の効率的な合成・従来不可能であった反応の達成、などを目標に、多くの研究者が日々挑戦を続けています。

今回の講習会では、「新たな挑戦」という切り口で、産・学における、最近の興味深い研究を勉強する機会を設けました。プログラムから、テーマとその内容、ご講師のご確認を、お願いいたします。

産業界からは、新たな創薬モダリティとして期待されている核酸医薬、従来の生産モデルを打ち破る連続生産、さらには有機合成化学協会賞（技術的なもの）を受賞された、新規酸化剤や新薬の効率的合成法、また、学界からは、脱カルボニル化、フローによるアシル化や超高速合成、オキソアンモニウム塩を用いた酸化などの新反応、新奇なホウ素含有化合物の性質や不安定化学種の取扱い、生体内での生理活性物質の合成など、非常に魅力的な研究をご紹介します。その際、ご講師の方々には、「講習会」という観点から、研究の背景を含む解説や実験ノウハウなども、可能な限り盛り込んでいただこうと考えております。

なお、今回の講習会は、遠方からのご参加に無理がないように、初日を午後からスタートすることにいたしました。そのため、ご好評をいただいておりますランチオンセミナー形式での企業からの事業紹介は第2日目に実施いたします。あわせて、従来と同様、会場で最新機器、試薬などの、展示によるご紹介も予定しております。

さらに、第1日目には、本講習会の特長であるイブニングセッションを、十分な時間を取って開催いたします。ここでは、第2日目のご講師にも可能な限りご参加いただき、リラックスした雰囲気の中、ご講師とのFace to Faceのコミュニケーションで、より理解を深めることができます。また、このセッションは、同業、異業種問わず、参加者間での情報交換、人脈・ネットワーク作りにもご活用いただけますので、是非、積極的にご参加ください。

本会は、通常の学会やシンポジウムとは異なる「講習会」であり、参加者の皆様の勉強の場のひとつと考えています。是非本講習会で「有機合成の新潮流 — 反応剤・反応・創薬 新たな挑戦 —」について勉強され、ご自身の研究に役立てていただければ幸いです。向学心あふれる皆様多数のご参加をお待ちしています。

日 時：平成30年6月13日(水)～14日(木)

会 場：日本薬学会長井記念館長井記念ホール
(東京都渋谷区渋谷2-12-15／TEL.03-3406-3326)

【交通】◎JR山手線・東急東横線・田園都市線、京王井の頭線、東京メトロ銀座線・半蔵門線「渋谷駅」下車、JR渋谷駅東口より高樹町方面へ高速道に沿って徒歩約8分

★12:55~13:00 開会挨拶

1 13:00~13:50 「日進月歩の芳香族化合物脱カルボニル型変換反応」

早稲田大学先進理工学部准教授 山口潤一郎

クロスカップリング反応などにおいて、カルボニル化合物が、安価で入手容易な代替カップリング剤（求電子剤）として注目を集めている。特に芳香族化合物の場合、カルボン酸を現状では用いることができないため、芳香族カルボン酸誘導体（エステル・アミド）などが用いられる。遷移金属触媒下、結合活性化／脱カルボニル化を伴い、形式的にエステルアミドが脱離基として反応するユニークな反応である。本講習では、最近発展著しい遷移金属触媒を用いた芳香族化合物の脱カルボニル型変換反応を紹介する。

2 14:05~14:55 「高反応性ホウ素化合物の化学：不安定化学種取り扱い入門」

名古屋大学大学院工学研究科教授 山下 誠

周期表で炭素の左に位置するホウ素を含む分子は有機合成化学において広く利用されている。通常使用される有機ホウ素化合物は、その分子構造に少し摂動を与えることで、合成化学の常識とは異なる反応性を示すことがある。本講習では新奇なホウ素含有化合物の特徴的な性質について我々の最近の研究を紹介すると共に、有機合成化学の現場における不安定化学種の取り扱い方法の入門編についても紹介する。

3 15:10~15:50 「核酸医薬開発へ向けた技術構築への挑戦」

協和発酵キリン㈱研究開発本部研究機能ユニット創薬技術研究所主任研究員 山本潤一郎

核酸医薬として siRNA や ASO は標的遺伝子の特異的な発現抑制が可能であり、低分子医薬や抗体医薬に次ぐ創薬モダリティとして注目されています。そこで、本講習会においては、従来の低分子医薬で用いられてきた創薬手法を核酸医薬にも展開し、SBDD に基づく siRNA アナログの分子設計や誘導体合成による高活性化、およびプロドラッグ化の研究事例を紹介します。

ブレイク20分

4 16:25~17:05 【(平成29年度)有機合成化学協会賞「技術的なもの」受賞講演】

「新規酸化剤『次亜塩素酸ナトリウム5水和物(SHC5)』

の工業化とその酸化反応への応用」

日本軽金属㈱化成品事業部蒲原ケミカル工場開発部グループリーダー 岡田 倫英

次亜塩素酸ナトリウム水溶液はクリーンかつ安価な酸化剤として広く知られているが、工業的に有機合成反応に使用する場合、希薄溶液であるため製造効率が悪く、また反応性も低いという課題があった。そこで当社は、これらの課題を解決すべく、高濃度で高い酸化力を持つ次亜塩素酸ナトリウム5水和物（SHC5）の工業的製造法を確立し、アルコール化合物や硫黄化合物等の酸化反応に対して有用な酸化剤であることを示した。本講習では SHC5 と従来品水溶液との反応性の違いを中心に有機合成への適用例を紹介する。

5 17:20~18:10 「生体内合成化学治療」

理化学研究所田中생체機能合成化学研究室主任研究員 田中 克典

私達は、「生体内合成化学治療」と名付けた方法で、生きている動物内での生理活性分子の合成に挑戦している。従来のように、活性を持つ分子を体内に導入して、疾患の治療効果を検討するのではない。活性や毒性のない原料や試薬を体内に導入して、体内の特定の場所で時空間的に生理活性分子をピンポイントで創製し、その活性を発現させる。有機合成化学によってこれまでドロップアウトしてきた分子を見直す「分子ルネッサンス」である。本講習では最新の成果を含めた私達の「生体内合成化学治療」を紹介する。

18:30~20:00 イブニングセッション(於：ロビー)

6 9:45~10:35 「マイクロフローリアクターを用いる高速・高効率アシル化反応」

東京工業大学科学技術創成研究院化学生命科学研究所准教授 布施新一郎

微小な流路を反応場とするマイクロフロー合成法を、生産効率向上のために単にバッチ合成法の代替として用いることでも多くの利益を得られるが、演者らはバッチ合成法では「制御不可能」な高反応性活性種をマイクロフロー法で活用することにより新しい化学(価値)を創造できるのではないかと期待して研究を続けてきた。本講習では、特にペプチドおよび関連化合物に焦点を当て、その重要性和従来合成法の問題点、そして演者らが開発してきた高反応性活性種を駆使する古くて新しいマイクロフローアシル化法の開発について紹介する。

7 10:50~11:30 「連続生産の社会実装への取組み」

株式会社ケミカル代表取締役社長 齋藤 隆夫

日本の化学合成産業は、低コスト国の中国、インド等の台頭をうけ、熾烈なコスト競争に巻き込まれ苦境に立たされている。また、自然災害のリスクや労働人口の減少により従来の生産モデルの崩壊は必至である。国際競争力の再興、合成事業復活の鍵は40%を超える省人化に対応できる全自動連続生産の導入に掛かっている。本講習では、多品種少量生産に対する連続生産の実装への取り組みについて述べる。

昼食&ランチョンセミナー&展示**8 13:00~13:50 「アルコールを効率的かつ選択的に酸化するために」**

名古屋大学大学院創薬科学研究科講師 澁谷 正俊

アルコールからカルボニル化合物への酸化は、有機合成の基本となる極めて単純な反応である。しかしながら、反応の実施にあたっては危険性や廃棄物の環境毒性、あるいは副反応等の問題に直面することが意外に多い。我々はオキソアンモニウム塩を触媒活性種とするアルコールの酸化反応の有用性に着目し、触媒構造や触媒反応系を適切に設計することによって、様々な酸化反応が効率的に進行することを見出してきた。本講習では、それらオキソアンモニウム塩を触媒活性種とする酸化反応について紹介する。

ブレイク20分**9 14:25~15:05 【(平成29年度)有機合成化学協会賞「技術的なもの」受賞講演】
「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」**

塩野義製薬(株)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

ドルテグラビルは HIV (ヒト免疫不全ウイルス) の増殖にかかわるインテグラーゼの阻害を作用機序とする抗 HIV 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の開発が必須であった。検討の結果、以下の二つの合成法、すなわち原料マルトールの酸化と気液反応 (Heck カルボニル化) を鍵反応とする合成法、および原料をゼロベースで見直し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。本講習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。

10 15:20~16:10 「フローマイクロリアクターを用いた超高速反応による精密合成」

京都大学大学院工学研究科講師 永木愛一郎

最近、マイクロ構造をもつフロー型の反応器であるフローマイクロリアクターが合成反応に利用できるようになってきた。本講習では、その特性を生かし、高い選択性で反応時間秒〜ミリ秒オーダーの反応の精密制御を実現することにより、フラスコでは達成困難な超高速合成の展開が可能となる、その原理とともにその最近の活用例について紹介する。

受講料(テキスト・送料／消費税含む)

参加費→ ↓会員資格	企業社員	学校・官公庁職員・研究生	学生(研究生除く)
主催・共催	33,000円	28,000円	16,000円
会員外	52,000円	42,000円	27,000円

*主催のシニア会員価格：17,000円

*本会普通会員（法人）所属の社員は会員扱いとします。

本会法人会員（特級～2級）は割引価格となります。詳細はHPをご覧ください。

*テキスト発送後にキャンセルを申し出られても理由の如何を問わず参加費返金できませんのでご注意ください。

◆定員

定員120名になり次第（座席指定制・先着順）

◆参加申込方法

下記の[1] or [2] でお申込み下さい。テキストは開催約1週間前に送付予定です。

[1] ホームページより<http://www.ssocj.jp/>

受信後、直ちに受付済のe-mailを送信します（この受信メールが届かない場合、お手数ですが再登録をお願いします）。

[2] FAX・e-mail等にて

①氏名、②勤務先、③電話番号、④連絡先(自宅・勤務先の区別を明記)、
⑤会員資格、⑥会員番号、⑦請求書・領収書希望の有無、以上を明記して受講料を添えて下記までお申込み下さい。

◆問合せ先

〒101-0062 東京都千代田区神田駿河台1-5

(公社)有機合成化学協会「講習会係」

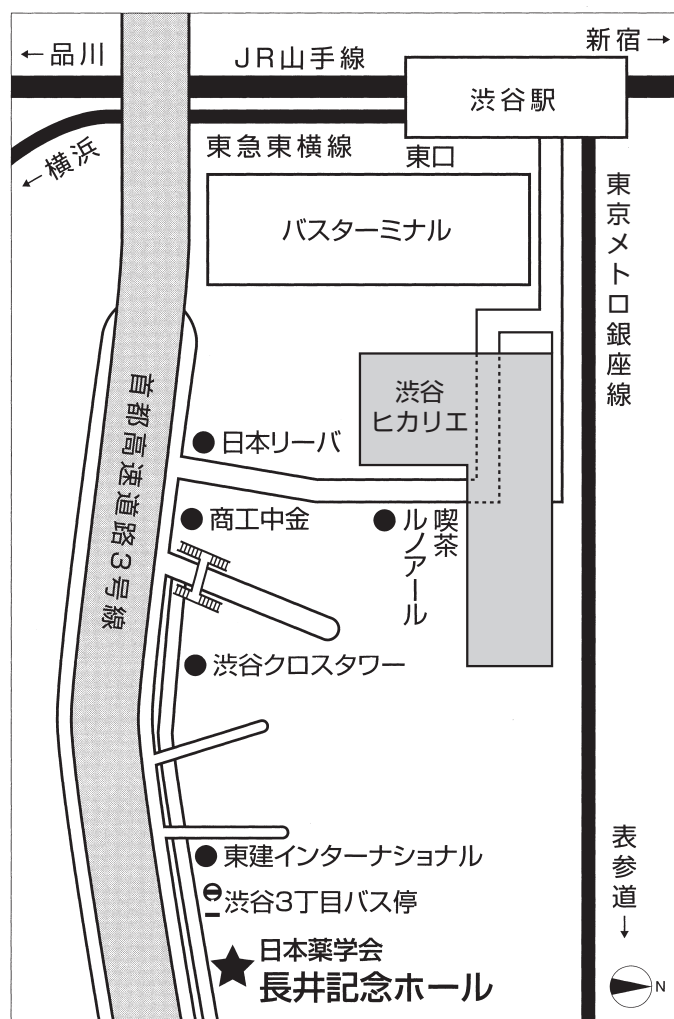
TEL：03-3292-7621, FAX：03-3292-7622

e-mail：syn.org.chem@tokyo.email.ne.jp

[1][2]ともお申込みと同時に、現金書留・郵便振替(00100-1-157690)

または銀行振込(みずほ銀行神田支店／普通預金／NO.1620638／名義：公益社団法人有機合成化学協会)にてご送金をお願いします。

■会場案内図



-----〈キリトリ線〉-----

平成30年度 前期(春季)有機合成化学講習会参加申込書

氏 名		受付番号	
会 員 資 格 ※該当箇所に☑を入れて下さい	☐ 有機合成化学協会 会員NO.		☐ 日本化学会 ☐ 日本薬学会 ☐ 日本農芸化学会 ☐ 会員外
	☐ 個人会員 ☐ 法人会員 ☐ 学生会員 ☐ シニア会員		
勤 務 先 名 または 学 校 名		職 名	
同 所 在 地	〒		
連 絡 先	〒 ☎ FAX e-mail: ※印をいれてください→自宅() 勤務先()		
受 講 料	円	送 金 方 法	現金書留・銀 行・郵便振替・その他
懇 親 会 いずれかに○印	参 加 不参加	備 考	
請求書・領収書 の 発 行	請求書発行 希望 () 不要 ()	領収書発行 希望 () 不要 ()	※入金確認後の 発行となります