

新時代に飛躍する有機合成化学 — 機能性分子、材料から創薬まで —

主催 有機合成化学協会 / 共催 日本化学会、日本薬学会 / 協賛 日本農芸化学会

有機合成化学は新たな構造や機能を有する分子の探索、目標とする分子の効率的な合成法の開発、従来法では不可能であった反応の達成、などを目標に、多くの研究者が参入し、日々挑戦を続けている研究分野であります。

今回の講習会では、「新時代に飛躍する有機合成化学」という主題を掲げ、新たな時代を迎えた産・学における、有機合成を基盤とする科学技術の最新的话题を勉強する機会を設けました。

産業界からは、セルロースナノファイバーやキラルカラムの開発、さらには睡眠障害治療薬を志向した創薬研究、また、学界からは、有機ラジカルを用いるタンパク質修飾法や新しい光反応性基の開発、柱型環状ホスト分子ピラー [n] アレーンの創成、高機能分子の自動探索、複雑天然有機化合物の合成研究、核酸医薬開発に向けた機能性人工ヌクレオシドの創製、核酸標的的低分子創薬を支えるゲノム化学など、数々の大変魅力的な研究をご紹介します。その際、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お話いただこうと考えております。

なお今回の講習会は、遠方からもご参加しやすいよう、第1日目を午後からスタートすることといたしました。そのため、以前より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につきましては、今回の講習会では第2日目に実施いたします。あわせて、これまでと同様に会場での最新の機器、試薬および材料などの、展示によるご紹介も予定しております。

さらに、第1日目の講習終了後には、これも本講習会の特長であります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日目の講師の方々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、講師の先生方との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、積極的にご参加いただければと思います。

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を提供させていただくものであります。是非、本講習会で「新時代に飛躍する有機合成化学—機能性分子、材料から創薬まで—」について勉強いただき、ご自身の研究に役立てていただけましたら幸甚です。向学心あふれる皆様のご参加を心よりお待ちしております。

日 時：2019年6月18日(火)～19日(水)

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

★13:00~13:10 開会挨拶

**1 13:10~14:00 「高機能分子の自動探索：
自動設計と自動合成の融合による機能性分子発明の自動化へ」**

産業技術総合研究所生命工学領域バイオメディカル研究部門主任研究員 石原 司

有機合成の極みの一つである医薬品の創出は、数年に渡る歳月と幾多の試行錯誤を伴い、生産力向上は製薬産業における至上命題と言える。近年における人工知能の進化は医薬候補化合物の設計を、ロボット技術の深化は化合物合成を、自動化しえる。我々は、医薬品創出に資する支援技術の確立に向け、自動設計と自動合成の具現化と融合による医薬候補化合物自動探索装置の完成を目指している。本講習では、創薬化学の現状を振り返りつつ、医薬候補化合物自動探索装置、ならびに、その試験稼働にて創製した化合物の概要を紹介する。

**2 14:15~14:55 「睡眠障害治療薬を志向したオレキシン1/2受容体
新規デュアルアンタゴニスト Lemborexant (E2006)の創製」**

エーザイ(株)ニューロロジ-ビジネスグループ(NBG)メディスンクリエイションディスカバリー-ニューロロジ-筑波研究部長 寺内 太郎

オレキシンは、睡眠・覚醒状態を制御するキーマediatorとしての生理的役割が示唆されており、不眠障害などに対する新たな創薬ターゲットとして注目されている。我々が創製した lemborexant は、ユニークな3置換シクロプロパン骨格を有するオレキシン1/2レセプターデュアルアンタゴニストであり、不眠障害を対象とした米国NDA申請を2018年に達成した。また、アルツハイマー型認知症に伴う不規則睡眠覚醒リズム障害を対象とした臨床開発も進行中である。

本講習では、lemborexant 創製につながった創薬研究の過程について発表する。

ブレイク20分**3 15:30~16:10 「知ってる人は知っている多糖誘導体系キラルカラムの意外な能力
～アキラル異性体分離例と計算科学による認識機構の解明～」**

(株)ダイセル新井工場CPIカンパニーライフサイエンス開発センター所長 大西 敦

多糖誘導体をキラル認識剤とするキラルカラムが、鏡像異性体だけでなく、広く位置異性体等の異性体類(アキラル化合物)の分子認識に優れていることは経験上、よく知られている。本講習では計算化学とアキラル化合物のクロマト保持挙動から、多糖系ポリマーによるアキラル化合物分離、キラルも含めた分子形状認識の考察とその応用例について報告する。

4 16:25~17:05 「セルロースナノファイバー開発の取り組み状況」

日本製紙株研開発本部CNF研究所長 河崎 雅行

日本製紙では木質バイオマスを利用した新規事業の開発を推進しており、その中でもセルロースナノファイバー(CNF)の開発に注力している。CNFは高い結晶性を有した天然ナノ素材で、自動車の軽量化を目指した各種部材、塗料・化粧品・食品などの添加剤、フィルム・不織布と複合化した高機能シートなど多様な利用が考えられている。日本製紙では各種CNFを製造しているが、その中で木質パルプを化学変性してナノ分散したTEMPO酸化CNF、カルボキシメチル化CNFについてその製法、特徴および用途開発の取り組み状況を紹介する。

5 17:20~18:10 「核酸標的的低分子創薬を支えるゲノム化学」

大阪大学産業科学研究所教授 中谷 和彦

ヒトゲノムの約8割はRNAに転写され、その多くが非翻訳RNAとして機能している。mRNAやこの非翻訳RNAを含めたDNA・RNA(以下核酸)は、従来創薬標的とされていた蛋白質とともに、今後重要な創薬標的となると考えられている。核酸を標的とする核酸創薬が盛んに研究されていますが、新たな創薬モダリティとして「核酸標的的低分子創薬」が、製薬企業各社の開発計画に上がりつつある。本講習では、核酸を化学的な視点で研究するゲノム化学から最新の低分子と核酸の相互作用研究について紹介する。

18:25~19:55 **イブニングセッション(於;ロビー)**

6 9:45~10:35 「有機ラジカルを用いるタンパク質修飾法の開発と応用」

東京大学大学院薬学系研究科講師 生長幸之助

タンパク質化学修飾法は、幅広い生命志向型応用に魅力があるツールである。我々は以前、有機ラジカル試薬を用いる金属フリーなトリプトファン選択的タンパク質修飾法を開発した。トリプトファンはほとんどのタンパク質に含まれる一方、他の天然アミノ酸に比べ表面露出数が少ない。このため本反応は均質な修飾体を得やすいという特長がある。本講習では、本反応の医薬応用および交差反応性を抑えるための取り組みについて述べる。

7 10:50~11:40 「柱型環状ホスト分子ピラー[n]アレーンの創成と空間材料化学への展開」

京都大学大学院工学研究科合成・生物化学専攻教授 生越 友樹

リング状ホスト分子は、その空孔内部にゲスト分子を取り込むというホスト-ゲスト機能を示すため、有機化学・超分子化学の分野において重要な鍵化合物である。2008年に我々は、簡単に合成することができる正n角柱状のリング状ホスト分子「ピラー[n]アレーン」を見出した。日本発のリング状ホスト分子「ピラー[n]アレーン」は、今では世界中の化学者に利用されるようになっていく。本講習では、ピラー[n]アレーンの特徴、及び最新のピラー[n]アレーンの応用展開について紹介する。

昼食&ランチョンセミナー&展示**8 13:30~14:20 「有機合成で新しいケミカルバイオロジーツールを創る」**

九州大学大学院薬学研究院教授 平井 剛

ケミカルバイオロジー研究に利用可能な分子ツールは、蛍光プローブや天然物・生物活性物質の誘導体など、これまでにたくさん開発されてきた。しかし、生命現象の解明にはまだ十分とは言えない。演者らは、独自の分子設計概念の下、新しいツール分子の開発に取り組んでいる。本講習では、糖(脂質)-タンパク質相互作用の解明に寄与することを目的とした研究について、最近までの成果を紹介する。

ブレイク20分**9 14:55~15:45 「稠密に官能基化された天然有機化合物の合成研究：複雑な分子を読み解く」**

東京工業大学理学院准教授 大森 建

複雑で一見手のつけようもなく見える天然有機化合物も、そこに潜んでいる基本的な有機合成的要素を探り出しそれを理解すると、これまで困難と思っていた合成が、まるで解けた知恵の輪のように、いとも簡単に実現できることがある。本講習ではいくつかの実例を挙げ、個々の場面でどのように問題を把握し、考え、それを解決したかを解説する。

10 16:00~16:50 「核酸医薬開発に向けた機能性人工ヌクレオシドの創製」

大阪大学大学院薬学系研究科教授 小比賀 聡

近年、新たな創薬モダリティとして核酸医薬が注目されている。我々は核酸の化学構造の中でも特に糖部(フラノース環部)に着目し、そのコンホメーション変化を抑制することで、相補鎖との二重鎖が安定化されるとの考えのもと、架橋型人工核酸2,4'-BNA/LNAを世界に先駆け設計・合成した。それ以降、我々は核酸医薬への利用を念頭に、新たな架橋型人工核酸の開発を継続して行っている。本講習では、いくつかの架橋型人工核酸についてその設計コンセプトから合成や機能の一端を紹介したい。

★17:05

閉会挨拶

イブニングセッション

(人・情報・話題のネットワークの拡がりを求めて)

初日プログラム終了後、同会場講師を囲んで質疑応答、討論をじっくり行うものです。また参加者同士の人脈交流の場として利用して頂いています。受講の方は無料です。

展示コーナー

講演に関連する材料や機器(情報集積・表示関連材料・機器、分子モデルソフト、コンピ関連機器、新試薬など)の展示を行います。

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。

*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<https://www.ssocj.jp/>

受信後、直ちに受付しました旨のe-mailを送信します(この受信メールが届かない場合、申込受付が未完了。お手数ですが再登録をお願いします)。

[2] FAX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

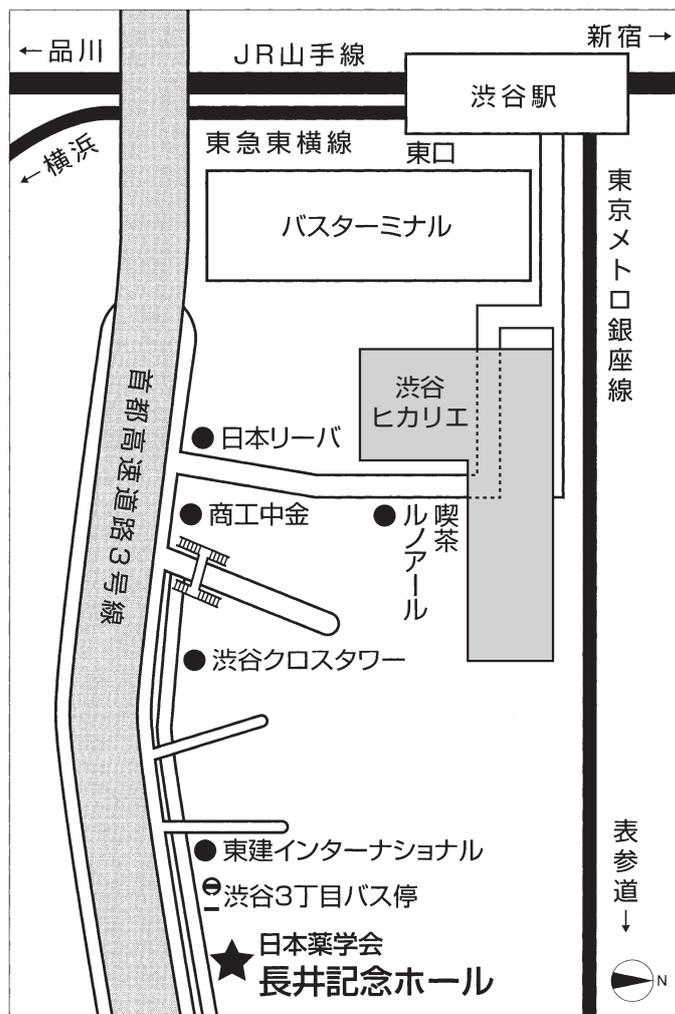
〒101-0062 東京都千代田区神田駿河台1-5

公益社団法人有機合成化学協会「講習会係」

TEL: 03-3292-7621, FAX: 03-3292-7622

[1][2]ともお申込みと同時に、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)

2019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 <small>※該当箇所に☑を入れて下さい</small>	<input type="checkbox"/> 有機合成化学協会 会員NO.			<input type="checkbox"/> 日本化学会 <input type="checkbox"/> 日本薬学会 <input type="checkbox"/> 日本農芸化学会	<input type="checkbox"/> 会員外	
	<input type="checkbox"/> 個人会員 <input type="checkbox"/> 法人会員 <input type="checkbox"/> 学生会員 <input type="checkbox"/> 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	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	