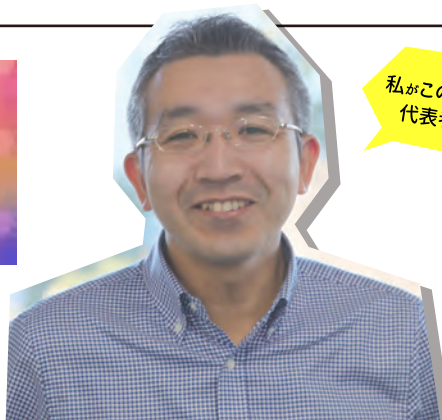




こぼつ



私がこの課題の代表者です

名古屋大学大学院創薬科学研究科 教授

よこしま さとし
横島 聡 先生
Satoshi Yokoshima

支援メニューはこちらを Click!

課題番号・課題内容

E6-1 構造最適化合成支援 など

東京大学博士（薬学）。三菱ウェルファーマ（株）、東京大学助手、助教、講師、准教授、名古屋大学准教授を経て、2017年より現職。
家では動物に囲まれる日々（猫 3 犬 1）。吹奏楽（楽器はサクソ）を部活と市民バンドでやっていましたが、最近はほとんど触れていません。



テニテラテテ

今まで主に取り組んできた研究

学生のときから天然物合成を行なっております。活性の有るもの無いもの、由来生物もいろいろですが、三次元的な広がりをもつ、面白い骨格をした化合物が標的として選ばれることが多いです。そのような分子は、構造解析の際の NMR も読み甲斐があり、また骨格特有の性質・反応性も見られることがあり、日々の研究で有機化学を楽しむことができます。

三次元的な広がりをもつ骨格は、タンパク質をはじめとする生体分子と効果的に相互作用するとされ、また物性や代謝特性の面からも医薬品開発において有用であるとの議論があります。これらの議論は、天然物そのものや天然物類縁体の医薬品シーズとしての可能性を示すものでありますが、ここに一つの問題が立ちまわります。それは、天然物の構造の複雑さに起因する合成の困難さです。優れた活性があるものの、類縁体を含めた化合物の供給に問題があるために、十分に研究を進めることができない、というものです。エーザイによるエリブリンの成功は、その状況は十分克服ができることを示していますが、あらゆる化合物を自在に合成可能な状況からは、現在でも程遠いところにあります。私が天然物合成を続ける理由はそこにあり、複雑な骨格の構築法を確立することで、天然物や天然物様の面白い骨格をもつ化合物を医薬品開発の俎上に載せることができればと、日々学生たちと一緒に奮闘しています。



NMR

この課題を支援しています



東海国立大学機構名古屋大学、大学院創薬科学研究科、教授

やまもと よしひこ
山本 芳彦 先生
Yamamoto Yoshihiko

支援メニューはこちらを Click!

課題番号・課題内容
E6-1 構造最適化合成支援

名古屋大学 博士（工学）、名古屋大学助手・准教授、東京工業大学准教授を経て2012年より現職。
好奇心・探究心を大切にして多くの研究者に使ってもらえる反応の開発と反応機構研究を進めています。

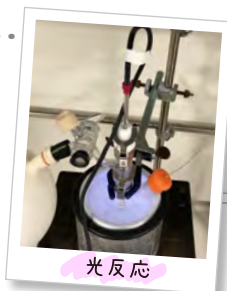
今まで主に取り組んできた研究

生物活性分子の高効率精密合成を指向し、分子触媒を駆使する分子変換法を開発しています。最近、安価なコバルト触媒と光レドックス触媒を組み合わせて、複数の結合を組み替えて鎖状不飽和化合物から一挙に複雑な環状分子へと異性化させる手法や、通常不活性な炭素-水素結合を開裂させて官能基化する直截的な分子変換法などの開発を進めています。また、医薬品の開発においてフッ素が重要な役割を果たしており、より広範なフッ素置換基導入法が求められていることから、含フッ素化合物の精密合成法にも注力しています。とくに、3次元的な分子骨格の sp³ 炭素上

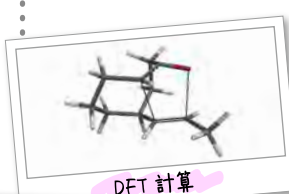
にフルオロアルキル基を導入する手法を研究しています。

また、生理活性化合物の構造展開を通して、生物科学研究者の支援を実施してきており、その成果は複数の共著論文に繋がっています。私どもの開発した分子変換法や、それによって創出される新奇分子が、生物科学研究者との共同研究に活かされることを願っています。

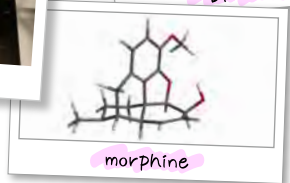
今後も、革新的な分子変換技術を開発して、生物活性分子合成の効率化を促進するとともに、魅力的な新奇分子を創出することで、創薬科学に貢献したいと考えています。



光反応



DFT 計算



morphine

今まで主に取り組んできた研究

約 15 年間、150 年以上前位から知られている古典的な化学種（ホスゲン、塩化チオニル、塩化スルフルル、三臭化リン、三塩化リン、クロロ酸アルキル等。三塩化リンの開発者はなんとヨウ素の名付け親でもある Gay-Lussac 先生！）を用いた反応開発に取り組んでいます。これらは安価で、高い反応性を持ち、構造がシンプルなため廃棄物量が抑えられて、夾雑物の除去が容易なものが多いですが、一方で副反応が抑えにくいために有用性が見過ごされていることが少なくありません。微小な流路を反応場として用いるマイクロフロー合成法を駆使して、その特長である精密な反応時

東海国立大学機構 名古屋大学大学院創薬科学研究科 教授

ふせ しんいちろう
布施 新一郎 先生
Shinichiro Fuse

東京工業大学博士（工学）、ケムジェネシス社研究員、ハーバード大学研究員、東京工業大学助教・准教授を経て 2019 年より現職。
微小な流路を溶液を流しながら反応させるフロー合成法に魅せられていますが、週末はお酒を消化管系にフローしています。

支援メニューはこちらを Click!

課題番号・課題内容
E6-1 構造最適化合成支援



自動マイクロフロー合成装置 シリシアア

間・温度制御により、これまでは不可能と思われてきた副反応の抑止が実現する場合があります。忘れ去られてきた古典的な反応に新たな価値を付与することで、新たな輝きを放つ「新輝反応」へとバージョンアップすることを目標としています。開発した新輝フロー反応が、二度とその有用性を失うことなく（=不老）、使われ続けて欲しいとの願いをこめ、名古屋大学東山キャンパスの所在地「不老町」にもあやかり、「新輝不老反応」と呼んでいます。新輝不老反応が医薬品の開発や生産の現場で将来活躍するようになることを心から願っています。

東海国立大学機構 名古屋大学大学院創薬科学研究科 准教授

支援メニューはこちらを Click!

課題番号・課題内容
E6-2 創薬標的分子探索支援

北海道大学 博士（薬学）、日本学術振興会海外特別研究員（ジョンズホプキンス大学）、大阪大学助手・助教を経て現職。
治療法のない疾患に苦しむ人々にとって光となる治療法開発につながる研究をしたい。そう願いながら、まだまだわからないことだらけの核酸化学に挑んでいます。

この課題を支援しています



こだま てつや
児玉 哲也 先生
Tetsuya Kodama

申請者の皆様へ

遺伝子機能の異常が原因となっている疾患は多く、外来遺伝子の侵入が疾患に繋がっている感染症を含めればその数はさらに増えます。核酸医薬はその異常な遺伝子（核酸）を直接標的にできる「核酸」からなる薬物で、低分子化合物・抗体では達成できなかった難治性疾患への適用が期待されています。私はこの核酸創薬に資する新しい核酸素材の開発を行なっています。最近では、核酸分解酵素耐性と低極性化を目指したヌクレオシド・ヌクレオチドや投与時に毒性が出ない工夫をした核酸塩基の開発を進めており、特に、核酸の機能である二重鎖形成を担保しつ

つも天然の核酸とは異なる立体化学をもつヌクレオシドやハロゲン化やアルキル化により脂溶性を向上させた核酸開発に挑んでいます。また、ヌクレオシドのプロドラッグ化や蛍光標識化などを通じて生物科学研究者の支援を実施しています。

臓器の取り替えや遺伝子治療が常識となるまでは、核酸医薬は重要な創薬研究対象であり続けると感じています。その重要な時代にあるからこそ、今後も本当に核酸創薬に資する新しい核酸素材とは何かを考えながら、創薬科学に貢献していきたいです。