

課題番号: **LS025**
助成額: 60 百万円

革新的分子合成法の開発を核とする独創的医薬シーズの創出

ライフ・イノベーション

生物・医学系

平成 23 年 2 月 10 日～平成 23
年 9 月 30 日 (補助事業廃止)

金井 求 東京大学大学院薬学系研究科 教授
Motomu Kanai

WEB ページ

<http://www.f.u-tokyo.ac.jp/~kanai/index.html>



研究背景

医薬分子の基本となる有機化合物は本来無限の多様性を持っているにもかかわらず、創薬の入り口で候補分子を「合成しやすさ」を基準に極端に限定せざるを得ない点は、現在の創薬および有機合成化学が直面する最大の挑戦的課題の1つであった。

研究目的・特色

標的分子の環境調和性高い自在合成法の確立を基盤として、優れた医薬機能が期待される候補骨格を医薬分子に戦略的かつ合成の難易度に依存されことなく大胆に取り入れて、人類の至宝である医薬の創出を分子合成の立場から強力に促進していくことが、本研究の目的・特色である。

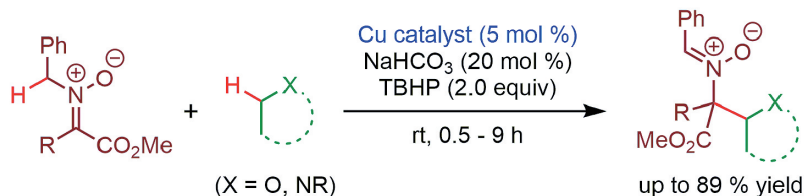
実績

代表論文: Org. Lett., 13, 4288-4291, (2011)

研究成果

水中、室温で進行する触媒的酸化カップリング反応

安価な銅触媒の存在下に、比較的安全性の高い酸化剤であるTBHPを用いることで、酸素や窒素といったヘテロ原子の隣接位 sp³ C-H 結合が選択的に活性化され、位置選択的な炭素-炭素結合形成反応が起きることを見出した。この成果は、安定で簡便に合成可能なニトロンの新しい反応性を見出した点と、複雑性化合物の合成へも展開できるレベルの温和な条件下で官能基選択的に反応が進行する点で評価できる。生成物も反応性を有するニロンであり、更なる変換により分子の構造複雑性を迅速に向上させることができた。



銅触媒による酸化カップリング反応

2030年の
応用展開

本研究を出発点として、多様な構造を有する医薬分子を、触媒の力で、Robust, Clean, Shortに供給できるようにしたい。それとともに、酵素反応を補完できる人工触媒反応を

生体内にて薬として用いることにより、新たな病態治療概念の確立に繋げる。