

《担当者名》教授 / 小林 健一      講師 / 平山 裕一郎

【概 要】

医薬品の合成において重要な炭素 - 炭素結合形成反応やクロスカップリング反応、医薬品の構造中に広くみられる代表的な芳香族複素環化合物の反応性と合成法について学び、医薬品合成化学を体系的に理解することを目的とする。また、医薬品開発において重要な天然物創薬研究の実例について学ぶ。

【学修目標】

- ・ 医薬品合成において重要な有機化学反応の特徴を理解し、反応機構を含めて説明できる。
- ・ 医薬品に特徴的な部分構造を理解し、その反応性や合成法について説明できる。
- ・ 生物活性天然物をシードとする天然物創薬について説明できる。

【学修内容】

| 回             | テーマ                     | 授業内容および学修課題                                                                          | 担当者    |
|---------------|-------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 1<br>)<br>2   | 炭素 - 炭素結合形成反応           | エノラートを中間体とする重要な炭素 - 炭素結合形成反応について、それぞれの反応の特徴や反応機構を説明できる。                              | 小林 健一  |
| 3<br>)<br>4   | 不斉合成と立体化学               | 有機反応におけるエナンチオ選択性とジアステレオ選択性について、具体例を挙げて説明できる。また、不斉プール法及び不斉補助基や不斉触媒を用いる不斉合成法について概説できる。 | 小林 健一  |
| 5<br>)<br>6   | 有機金属化学                  | 鈴木・宮浦クロスカップリングや根岸クロスカップリングなど、医薬品合成に広く利用される種々の遷移金属触媒クロスカップリング反応について、具体例を挙げて説明できる。     | 小林 健一  |
| 7<br>)<br>8   | 芳香族複素環化合物               | 医薬品に含まれる代表的な芳香族複素環化合物を列記し、それぞれの構造、反応性、合成法について説明できる。                                  | 小林 健一  |
| 9             | 医薬品の合成                  | 1～8回の講義内容が医薬品合成の現場でどのように利用されているか、具体例を挙げて説明できる。                                       | 小林 健一  |
| 10            | メディシナルケミストリーとプロセスケミストリー | 医薬品開発におけるメディシナルケミストリーとプロセスケミストリーのそれぞれの役割について、具体例を挙げて概説できる。                           | 小林 健一  |
| 11<br>)<br>12 | 天然有機化合物をベースとする医薬品       | 多くの医薬品が天然有機化合物そのものであったり、その構造をベースにして開発されている。これらの天然物を元にした医薬品について概説できる。                 | 平山 裕一郎 |
| 13            | 天然物からの医薬品シードの探索         | 医薬品のシードとなる生物活性天然物の探索方法としての各種スクリーニングアッセイや、単離・構造決定の方法論について説明できる。                       | 平山 裕一郎 |
| 14<br>)<br>15 | 天然有機化合物の作用機序の解明         | 天然有機化合物の作用機序の解明研究について、いくつかの実例を元に概説できる。                                               | 平山 裕一郎 |

【授業実施形態】

面接授業

授業実施形態は、各学部（研究科）、学校の授業実施方針による

【評価方法】

受講態度（30％）と課題レポート（70％）で評価する。

【教科書】

プリント配布

【参考書】

ウォーレン 有機化学 上 第2版（東京化学同人）  
ウォーレン 有機化学 下 第2版（東京化学同人）  
パートナー天然物化学 改訂第4版（南江堂）

【学修の準備】

授業に関連する学部講義レベルの内容について、事前に復習して理解しておく。

【実務経験】

小林 健一（製薬企業研究業務）  
平山 裕一郎（企業研究業務）