

「実践的有機合成を基盤としたケミカルバイオロジー研究部門」  
*Chemical Biology Division Supported by Practical Organic Synthesis*  
 設置期間：2018年4月1日～2021年3月31日

実践的有機合成技術の開発・応用グループ（4名）

研究部門長・理学部第一部応用化学科	教授	○椎名	勇
グループ長・理学部第一部応用化学科	准教授	○川崎	常臣
理学部第一部応用化学科	講師	殿井	貴之
[客員准教授] 島根大学総合理工学部	准教授	中田	健也

ケミカルバイオロジー・医薬品開発グループ（9名）

グループ長・理学部第一部化学科	准教授	○下仲	基之
薬学部生命創薬科学科	教授	樋上	賀一
薬学部薬学科	准教授	○真野	泰成
理工学部応用生物科学科	准教授	諸橋	賢吾
理工学部先端化学科	講師	酒井	健一
理学部第一部化学科	助教	長谷川	豪
[客員教授] 東京電機大学理工学部	教授	長原	礼宗
[客員教授] 千葉大学真菌医学研究センター	教授	亀井	克彦
[客員准教授] 千葉大学真菌医学研究センター	准教授	石和田	稔彦

○は運営委員会委員

「実践的有機合成を基盤としたケミカルバイオロジー研究部門」

東京理科大学発の新規物質を用いた生物活性相関研究

実践的有機合成技術の開発・応用グループ

リダイフェン合成チーム

椎名 勇	}	多成分連結反応
殿井 貴之		脱水縮合反応
中田 健也		有機/金属触媒反応
		ペリ環状反応

不斉合成・天然物合成チーム

椎名 勇	}	非ステロイド性抗炎症薬
川崎 常臣		特殊アミノ酸
殿井 貴之		ボロノアミノ酸-10B
中田 健也		天然有機化合物・全合成

ケミカルバイオロジー・医薬品開発グループ

リダイフェンプロジェクトチーム

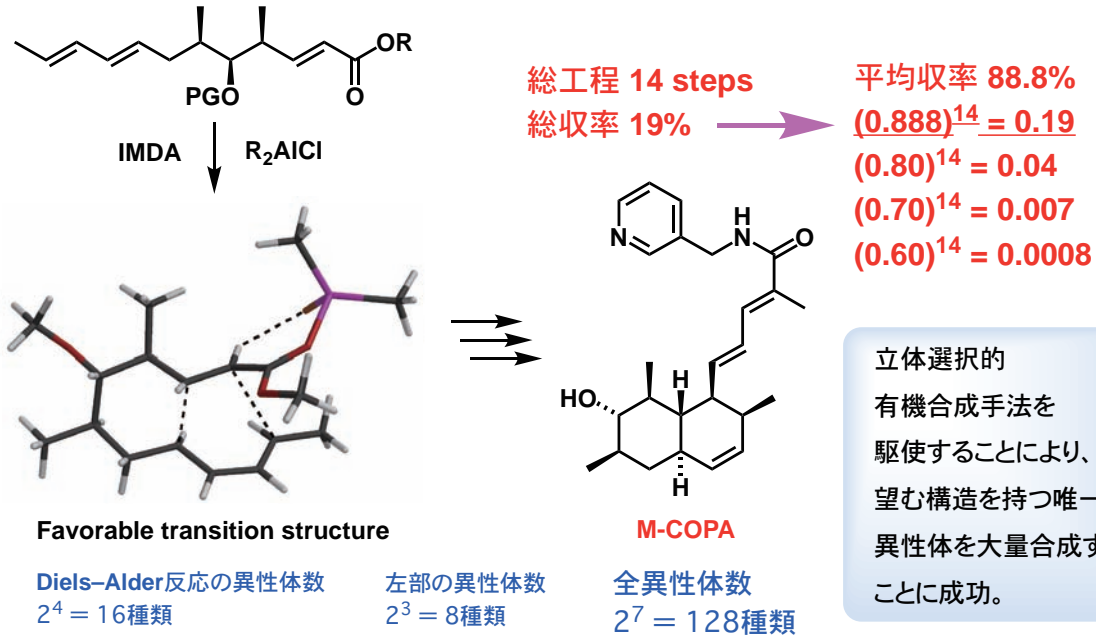
下仲 基之	}	第一世代リダイフェン
樋上 賀一		～第四世代リダイフェン
真野 泰成		第五世代リダイフェン (RCOP)
諸橋 賢吾		経皮薬 (皮膚がん)
酒井 健一		リボプロフェン (抗高脂血症薬)
長谷川 豪		M-COPA (抗がん剤)
長原 礼宗		

活性試験・メカニズム解析チーム

下仲 基之	}	ホウ素中性子捕捉療法 (BNCT)
長原 礼宗		マクロライド系抗生物質
亀井 克彦		・ユーシェアリライド
石和田 稔彦		・ノナクチン、デブシペプチド
		ボトシニン (農薬)
		EPM、BG、VA等

## 研究成果ハイライト①

# 抗がん剤 M-COPA の高効率不斉全合成

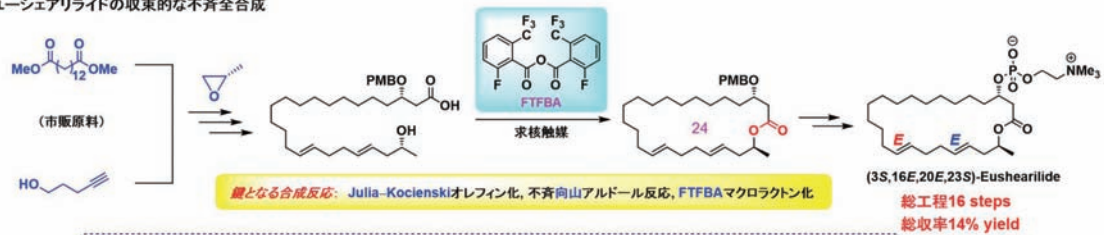


特許6143266 (2017年5月19日取得) (M-COPA全合成, 鍵合成中間体の物質・製法特許)  
PLOS ONE 12(4), e0175514 (2017). (マスト細胞腫)  
Cancer Letters 415, 1 (2018). (イマチニブ耐性GIST)

## 研究成果ハイライト②

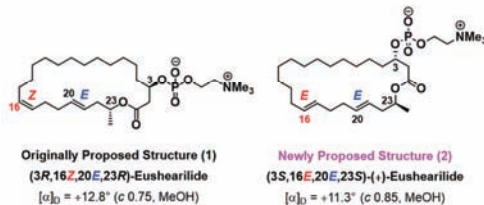
# 新規抗生物質ユーシェアリライド

### 1. ユーシェアリライドの収束的な不斉全合成



立体選択的有機合成手法を駆使することで、安価な市販原料から高付加価値を有する新規抗生物質の大量合成法を確立。

### 2. 合成品の構造決定



天然物の絶対立体配置の決定に世界で初めて成功。

### 3. 天然型ユーシェアリライドの抗菌活性

microorganism	strain No.	compound*
		(3S,16E,20E,23S)-2
<i>Trichophyton mentagrophytes</i> (白黴菌)	NBRC 5466	47.3
<i>Aspergillus niger</i> (黒コウジ菌)	NBRC 105649	4.3
<i>Staphylococcus aureus</i> (黄色ブドウ球菌)	NBRC 12732	1.3
<i>Staphylococcus aureus</i> (黄色ブドウ球菌)	IID 1677 (MRSA)	1.4
<i>Staphylococcus aureus</i> (黄色ブドウ球菌)	ATCC 43300 (MRSA)	3.0
<i>Enterococcus faecalis</i> (腸球菌)	ATCC 29212	7.6
<i>Enterococcus faecalis</i> (腸球菌)	ATCC 51575 (VRE)	4.7

\*The clear zone of inhibition (mm) around a paper disk impregnated with an antimicrobial agent at a concentration of 50 µg/disk.

(参考)「阻止円の測定」  
ディスク拡散法による薬剤感受性試験 (農林水産省資料)

黄色ブドウ球菌や腸球菌等の細菌類に対しても強い抗菌活性を示すことを見出した。

WO 2016068220 (2016年5月6日公開) (ユーシェアリライド全合成, 鍵合成中間体の物質・製法特許)  
Tetrahedron Letters 2015, 56, 1356-1359. (ユーシェアリライドの全合成)  
Journal of Antibiotics 2016, 69, 697-701. (ユーシェアリライドの絶対構造決定)  
Journal of Organic Chemistry 2018, 83, 7886-7899. (ユーシェアリライド異性体の合成と抗菌活性)