



FRONTIER NEWS

April 2022

Number 35号

挨拶

創薬科学フロンティア研究センター長

薬品化学分野 大石 真也



2022年4月より、薬品製造学分野山下正行教授に代わり創薬科学フロンティア研究センター長を拝命いたしました。私は2020

年4月に本学に着任いたしました。それ以来本学では新型コロナウイルス感染症のためにさまざまな制約のある中での研究活動が続いております。平時のフロンティア研究センターを経験したことがない中で担当を仰せつかることとなり不安ばかりですが、関係の先生方のご支援を仰ぎながら、任を果たしてまいりたいと思います。

さて、創薬科学フロンティア研究センターが設置された1999年頃には、ブロックバスターとして期待された多くの医薬品候補化合物は経口投与を想定したものであり、いわゆる低分子医薬品に分類される有機化合物が医薬の中心的な役割を果たしていました。その後、2000年代には抗体やサイ

トカインなどの多数のタンパク質製剤が開発され、2010年代には遺伝子改変を加えた細胞を医療に応用するさまざまな試みが実用化されました。また、このCOVID-19では、ワクチンの素材としてRNAを利用する選択肢が加わり、1990年代後半では予想されていなかった素材・技術が医療に利用されるようになっていきます。このように、創薬科学のフロンティアは移ろいゆくものであり、多様な研究領域間での密接な連携を通して新しいアイデアを創出していくことが不可欠であると考えられます。当センターが2024年に設立25周年を迎えることを見据えて、創薬科学の先端研究を担うセンターの役割をさらに充実させていきたいと考えております。

おわりに、当センターの構成員の人事異動をご紹介します。薬品製造学分野の山下正行教授は、2022年3月末日をもって定年退職を迎えられました。山下教授は、1991年から約31年の長きにわたり本学教員としてお勤めになり、また創薬科学フロンティア研究センター長としてもご尽力されました。後任の薬品製造学分野教授には、富山大学薬学部より南部寿則先生が4月1日付で着任されました。小島直人准教授・岩崎宏樹助教と協力しながら、薬品製造学分野の研究がさらに発展していくことを期待しております。また、施設を共用している共同利用機器センターの長谷川功紀准教授と安東友繁助教は、それぞれ2021年3月末日と同12月末日付で退職されました。創薬科学フロンティア研究センターでは、この4年の間に6名の新たなスタッフを迎えました。新たなメンバーを

含む構成員間の連携により、創薬化学系の教育・研究の充実を図ってまいりたいと思います。引き続きみなさまのご支援のほどよろしくお願い申し上げます。

創薬科学フロンティア研究センター講演会

澤田 浩隆 博士 (Group leader, Bioanalysis, USA) 講演会

日時：2021年4月23日(金) 16:00~17:30

場所：オンライン開催

演題：海外で薬づくりをしてみよう

～製薬業界で海外転職 体験記～

澤田博士は現在アメリカの受託分析機関にて創薬研究や臨床試験に従事されており、日本の製薬会社から海外に転職した



ご経験と、アメリカの製薬業界の現状を踏まえ講演していただきました。まず、日本の製薬企業での医薬品開発について概説していただき、体験談や裏話も交えながら日本での医薬品開発の課題や展望について紹介されました。また、転職や渡米した動機についてもお話され、1) 行動力が大事であること、2) ある程度の英語力は必要であるが渡米してからでもなんとかなる、とおっしゃっていたのが印象的でした。アメリカの創薬研究から承認に至るまでのスピード感や日本の制度との違いについても、私見を交えながらざっくばらんに述べられていました。海外留学を考えている人だけでなく創薬関連企業への就職を希望する学生にとって非常に興味深い内容であり、オンライン開催ということもあって、多くの分野からの参加をいただきました。講演後も多くの学生さんから質問があり、大変有意義な講演会になったと思います。

新任のご挨拶

創薬科学系 薬品製造学分野

教授 南部 寿則



2022年4月1日付で、創薬科学フロンティア研究センター長であった山下正行教授の後任として、薬品製造学分野を担当させていただきますことになりました。

私は、1999年に大阪大学薬学部を卒業後、同大学院薬学研究科に進学し、北泰行教授のもと2004年に博士(薬学)の学位を取得しました。その後、スイス連邦工科大学チューリヒ校化学科(Erick M. Carreira 教授)にて博士研究員として従事し、2005年より北海道大学大学院薬学研究院(橋本俊一教授)で助手、助教を経て、2012年からは富山大学大学院医学薬学研究部(薬学)(矢倉隆之教授)の准教授として着任し、有機化学の教育・研究に携わってまいりました。

阪大では水中でのラジカル反応の開発、スイスETHではアルケンのヒドロアジド化反応の開発、北大では不斉ロジウム(II)触媒反応の開発と天然物合成への応用、富大ではスピロシクロプロパンの開裂一環化反応の開発と有用化合物合成への応用に取り組んでまいりました。多岐にわたる研究内容ですが、研究を行ううえで念頭に置いていることは、医薬品創製に役立つ実用的な合成法を開発する、ということです。これまでに得た知識と経験を活かし、本学でも創薬を指向した生物活性化合物の効率的合成法の開発を目指すとともに、本学のさらなる発展に貢献してまいりたいと思います。また、研究を通して学生をしっかりと教育し、社会で活躍できるファーマシスト・サイエンティストを育成するために尽力してまいります。皆さまのご指導ご鞭撻を賜りますよう、よろしくお願い申し上げます。

退職の挨拶

創薬科学系 薬品製造学分野

教授 山下 正行

2019年4月より創薬科学フロンティア研究センター長を、薬品化学分野赤路健一教授（現京都薬科大学学長）より引継ぎ3年が



経過し2022年3月をもって定年退職しました。就任当初は、例年通りの研究活動ができていましたが、2019年12月に中国で初めて報告され、今もなお世界的な流行を見せている新型コロナウイルス感染症（COVID-19）により様子が一変しました。大学構内への入構禁止やリモートワークの推奨、研究室への入室可能人数の設定など研究・教育が大幅に制限されたため研究活動にも支障が出てしまいました。この間、対面による学会の中止やオンライン配信による開催になるなど大幅な変更が行われました。当センターでも開催している創薬科学フロンティアシンポジウムの開催を見合わせざるを得なくなりました。今後早い時期に開催されることを願うばかりです。次期センター長へ引き継ぎたいと思います。

さて、私は、1979年本学卒業後、1991年に化学教室（後に機能分子化学分野に改名）の助手として着任しました。着任後一貫して有機化学系の講義・実習を担当し、研究では新規有機合成反応や天然物合成を行ってまいりました。機能分子化学分野は創薬科学フロンティア研究センター棟と同じ南校地内にある南校舎にあり、当初は創薬科学フロンティア研究センターの一員ではありませんでした。南校舎の解体や薬学6年制による講義内容の見直しにより、2010年4月機能分子化学分野と薬品製造学分野は統合され、南校舎から創薬科学フロンティア研究センターに移り、「薬品製造学分野」

の名称を引き継ぎました。

京都薬科大学に職を得て約31年、創薬科学フロンティア研究センターに移り12年という長きにわたり、ご支援・ご指導いただきました皆様に厚く御礼申し上げますとともに今後も京都薬科大学、そして創薬科学フロンティア研究センターが益々発展し医薬業界で活躍する有為な人材を輩出することを祈念し、退職の挨拶とさせていただきます。皆様大変ありがとうございました。

2021年度受賞

学会受賞等リスト

第2回 和漢医薬学会若手研究者フォーラム 奨励賞
受賞者：米田 太一（生薬学分野）

演題：ニンニク由来不安定化合物 thioacrolein を利用したチオピランの合成およびその活性評価
演者：米田太一，中村誠宏，松本崇宏，今堀大輔，小島直人，渡辺徹志（京都薬大）

第80回 日本癌学会学術総会 JCA 若手研究者ポスター賞

受賞者：Shota Ando（臨床腫瘍学分野）

演題：JCI-20679 suppresses proliferation of glioblastoma stem cells via activation of AMPK and decrease of NFAT1（共同研究）

演者：Shota Ando, Naoto Kojima, Chiami Moyama, Mitsugu Fujita, Hiromi Ii, Susumu Nakata（京都薬大）

第71回 日本薬学会関西支部大会 優秀ポスター発表賞

受賞者：小柴 佐和子（薬品製造学分野）

演題：シクロペンタン環により配座を固定したアセトゲニンチオフェン誘導体の合成と活性評価

演者：小柴佐和子，細見紘幸，松本卓也，上田拓，小菅真央，飯居宏美，中田晋，岩崎宏樹，山下正行，小島直人（京都薬大）

課程博士学位記授与者

2022年1月24日（月）にA31講義室およびオンライン同時配信により、課程による博士学位論文口述発表が行われ、活発な質疑応答が行われました。その後、主査・副査による審査が行われました。

○村井 琢哉（薬化学分野）

博士（薬科学）2022年3月19日授与

【学位論文題目】カルコゲン結合を介して配座制御したロジウム二核錯体の創製と不斉C-H挿入反応への展開

○大谷 拓也（薬品化学分野）

博士（薬学）2022年3月19日授与

【学位論文題目】ペプチド性ヒドロキシエチルアミン型BACE1阻害剤におけるP1'置換型誘導体および大環状誘導体の合成と活性評価

○米田 太一（生薬学分野）

博士（薬学）2022年3月19日授与

【学位論文題目】ニンニク (*Allium sativum*) から得られるチオアクロレインを利用した抗がん作用を有するチオピランの合成研究

学士学位記授与者

2021年6月21日（月）～24日（木）、創立130周年記念館において総合薬学研究卒業論文発表会が行われました。コロナ禍のため入場者数に制限はありましたが、創薬科学フロンティア研究センターに所属する創薬科学系分野の6年次生は、22

日（火）14:00～15:20に英語で作成したポスターを用いて約2年半に及ぶ分野内で行った研究について発表し、活発な質疑応答を行いました。それらの成果を含めた結果をまとめた卒業論文を提出しました。



○飯田 雅士（薬化学分野）

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】Electronic Tuning 型ニトロキシル酸化触媒による第二級水酸基選択的酸化

○井上 拓美（薬化学分野）

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】縮環構造内に硫黄を持つ二核ロジウム触媒と[7]ヘリセン様化合物の合成

○鎌田 涼平（薬化学分野）

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】軸性不斉アニリン性酸塩基触媒による芳香族アルデヒドの触媒的イミノ化

○木元 聖哲（薬化学分野）

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】アニリン性酸塩基触媒による糖由来ジアルデヒドの分子内不斉アルドール反応

○杉本 晃一（薬化学分野）

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】ニトロキシル型酸化触媒による*p*-メトキシベンジルエーテルの酸化

○京田 光貴 (薬品化学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】オクタヒドロイソクロメン型 SARS 3CL プロテアーゼ阻害剤の合成研究

○桑野 芽 (薬品化学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】*N*-アミジノピロリジン骨格を母核とした BACE1 阻害剤の構造活性相関研究

○田中 紗織 (薬品化学分野)

2022年3月19日授与

【学位論文題目】ジペプチド型 Wnt シグナル伝達経路阻害剤の設計と合成ならびに活性評価

○丹田 朱音 (薬品化学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】光官能基を有する EGFR 二量体阻害環状ペプチドを用いた結合部位の同定研究

○堀内 南瑠 (薬品化学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】レトロインベルソ型 HTLV-1 プロテアーゼ阻害剤の合成研究

○藤原 怜彬 (薬品化学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】ヒスチジン誘導体を含む Wnt シグナル伝達経路阻害剤の設計と合成、活性評価

○大久保 知泰 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】Anthracene-2-carboxylic acid を用いるビアントラニル型 CD 発色試薬の合成

○大槻 杏果 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】糖尿病患者の生体内でメイラード反応により生成するテトラヒドロピリジン誘導

体の合成研究

○大野 紗希 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】*In vivo* 試験のためのアセトゲニンチオフェン誘導体の大量合成研究

○岡田 穂那 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】光学活性 *N*-アシル-4,5,6,7-テトラヒドロ-1*H*-イミダゾ[4,5-*c*]ピリジン誘導体の合成研究

○草野 桜 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】ヨウ化サマリウムを用いた 2-trifluoromethylindoline 骨格形成反応における置換基効果の検討

○久保田 由美 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】SmI₂によるラジカルイプソ置換型反応を用いた位置選択的閉環反応の検討

○小菅 真央 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】THF 環部分を構造簡略化したアセトゲニンチオフェン誘導体の 1-アルキルシクロペンタン-*trans*-1,2-ジオール骨格の合成研究

○後藤 瑞貴 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】*In vivo* 試験のためのアセトゲニンチオフェン誘導体の大量合成研究

○小林 達弥 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】Anthracene-2-carboxylic acid を用いるビアントラニル型 CD 発色試薬の合成

○武田 賢昭 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】不斉アルキニル化反応を経由する光学活性オキサゾリジノン誘導体のワンポット合成における芳香族アルデヒドの適応範囲の検討

○竹見 里穂 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】イソキノリン *N*-オキシドを反応中間体とするイソキノリン *one-pot* 合成反応の開発

○田中 菜津子 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】*In vivo*試験のためのアセトゲニンチオフェン誘導体の大量合成研究

○田中 雄一郎 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】3-Oxo-3*H*cycloalka[*b*]cyclobuta[*d*]pyrane-2*a*-carboxylate の硫黄イリドによる骨格変換反応

○中野 真央 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】がん転移抑制薬の開発を目指したクマリン誘導体の合成と構造活性相関研究

○藤原 純香 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】がん転移抑制薬の開発を目指したクマリン誘導体の合成と構造活性相関研究

○麓 敦也 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】グアノシン誘導体合成における保護基の検討

○星野 恭子 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】がん転移抑制薬の開発を目指したクマリン誘導体の合成と構造活性相関研究

○細見 紘幸 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】THF環部分を構造簡略化したアセトゲニンチオフェン誘導体の1-アルキルシクロペンタン-*trans*-1,2-ジオール骨格の合成研究

○松尾 実紗 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】不斉アルキニル化反応を経由する光学活性オキサゾリジノン誘導体のワンポット合成における芳香族アルデヒドの適応範囲の検討

○松田 千尋 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】不斉アルキニル化反応を経由する光学活性オキサゾリジノン誘導体のワンポット合成における芳香族アルデヒドの適応範囲の検討

○三須 健太郎 (薬品製造学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】SEDを用いた3-ヒドロキシメチルインドール誘導体合成法の開発

○青木 研一郎 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】トリテルペンの3位の水酸基の立体配置の違いによるトリテルペン類の一酸化窒素産生抑制作用の比較研究

○田中 舞子 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】X線曝露による細胞障害に対するフラボノイドの影響と構造の関係性

○岡崎 彩香 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】*Allium* 属植物を用いた含窒素芳香環化合物の合成と抗ウイルス作用の評価

○岡村 龍一 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】ニンニクの成分を鍵中間体とする含硫黄環状化合物の合成およびそれらのがん幹細胞毒性作用

○奥井 翔吾 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】抗がん作用を有する含硫黄医薬品シーズの開発を目的としたニンニク成分を鍵中間体とする多様な含硫黄鎖状化合物の合成研究

○澤田 見宇 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】アマチャ (*Hydrangea macrophyllavar. thunbergii*) の採取時期ごとの主要成分の含量と臍リパーゼ阻害作用の比較

○下岡 美咲 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】ヒキオコシのがん細胞転移抑制作用成分が特異的に結合するタンパク質の解析

○辻田 彩 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】天然型および非天然型ショウガ由来芳香族化合物の誘導体合成と生物活性評価

○角岡 常成 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】アブラナ科植物ホソバタイセイ含有成分を用いた含窒素複素環化合物の開発研究

○濱本 桜子 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】天然由来トリテルペン、ステロイド類の抗単純ヘルペスウイルス活性と機械学習モデルを用いた活性予測値との比較研究

○細田 依里 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】血液脳関門透過性ハス特徴成分の神経突起伸長作用

○宮川 晃也 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】天然薬物由来カルバゾール型アルカロイド eustifoline 類の合成と活性評価

○森川 葵 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】三黄瀉心湯の血管平滑筋弛緩作用における baicalin および berberine の寄与と作用機序の検討

○諸頭 佑香 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】糖化タンパク質の樹状突起伸展抑制に対する指甲花 (*Lawsonia inermis*) 花部成分の改善作用

○山下 遥加 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】天然由来成分シクロヘキセニルカルコン panduratin A とその誘導体の合成および活性評価

○山下 真由子 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】ビヨウヤナギの花部成分 3,8"-biapigenin の β -hexosaminidase 遊離抑制作用

○米山 真穂 (生薬学分野)

2022年3月19日授与

【卒業論文題目】 B16 melanoma 4A5 細胞における糖化タンパク質によるメラニン生成への影響

単結晶X線構造解析装置

XtaLAB Synergy-DW (株式会社リガク) の導入

文部科学省令和3年度私立学校施設整備費補助金(教育装置)の事業により共同利用機器として単結晶X線構造解析装置一式が導入されました。この装置はXtaLAB Synergy-DW(株式会社リガク)であり、従来機のRapid II(リガク)との入れ替え機です。管理分野は引き続き薬品製造学分野・共同利用機器センターが担当します。従来機に比べ装置や解析ソフトの飛躍的進歩により、極微小サンプル(一辺 $10\mu\text{m}$ 程度)での測定も可能になり、単離量の少ない天然物化合物の解析にも有用な手法となります。さらに、従来機では測定不可能であったタンパク質、ペプチドなどの生体高分子の測定・解析も可能となっています。また、従来機ではMo、Cuの線源の交換はサービスマンに依頼していましたが、本機種はボタン操作での切り替えが可能であり利便性が向上し、研究・教育が格段に進歩することが期待されます。



FRONTIER NEWS No. 35

2022年4月 編集・発行

京都薬科大学創薬科学フロンティア研究センター
〒607-8412 京都市山科区御陵四丁野町1番地
TEL: 075-595-4635, Fax: 075-591-9900

