

平成 28 年度 委託研究開発成果報告書

I. 基本情報

事業名： (日本語) 創薬基盤推進研究事業
(英語) Research on Development of New Drugs

研究開発課題名： (日本語) アcademia創薬を担う次世代のメディシナルケミストと薬物動態/物性評価研究者の育成
(英語) Training of Next Generation Medicinal Chemists and Pharmacokinetic / Physical Property Evaluation Researchers responsible for Academia Drug Discovery

研究開発担当者 (日本語) 国立大学法人大阪大学 大学院薬学研究科 教授 辻川和丈
所属 役職 氏名： (英語) Grad. Sch. Pharm. Sci., Osaka Univ., Prof. Kazutake Tsujikawa

実施期間： 平成 28 年 4 月 1 日 ～ 平成 29 年 3 月 31 日

分担研究 (日本語) メディシナルケミストと高度技能メディシナルケミストの育成
開発課題名： (英語) Training of medicinal chemists and medicinal chemists with advanced skills

研究開発分担者 (日本語) 国立大学法人大阪大学 大学院薬学研究科 教授 赤井周司
所属 役職 氏名： (英語) Grad. Sch. Pharm. Sci., Osaka Univ., Prof. Shuji Akai

II. 成果の概要 (総括研究報告)

本研究では、メディシナルケミストや薬物動態/物性評価研究者の育成とメディシナルケミストにおける高度技能育成研究が進められた。その結果下記のような成果を得た。

1. RNA 脱メチル化酵素 prostate cancer antigen-1 (PCA-1)の選択的阻害剤を取得した。
2. 質量分析装置を用いてエピトランスクリプトーム解析系が構築された。
3. 新規 RNA 修飾塩基の同定がなされた。
4. キノリン類に於いて、2通りの位置で脱酸素フッ素化法を行う新手法を開発した。一方、この方法ではピリジン類のフッ素化が進行しなかったため、代替法を見出した。

5. 神経変性疾患を含む新規中枢神経疾患治療薬の創製を目指し、transient receptor potential channel のアンタゴニストの誘導体展開を進めた。

In the preset project study, training of medicinal chemists and drug kinetics/physical property evaluation researchers as well as advanced skills training research by a medicinal chemist were carried out, and obtained the following results:

1. The selective inhibitors for RNA demethylase prostate cancer antigen-1 (PCA-1) were obtained.
2. Analysis system of epitranscriptome has been established using mass spectrometers.
3. Novel modified RNA bases were identified.
4. Two types of the deoxyfluorination protocols for quinoline derivatives have been invented. Since the deoxyfluorination was hardly applicable to pyridine derivatives, an alternative approach for the introduction of fluorine into pyridines was discovered.
5. To obtain a novel drug for central nervous system diseases including a neurodegenerative disorder, drug discovery of transient receptor potential channel agonists was progressed.

III. 成果の外部への発表

- (1) 学会誌・雑誌等における論文一覧（国内誌 0 件、国際誌 0 件）

無し

- (2) 学会・シンポジウム等における口頭・ポスター発表

1. RNA epigenetics 解析と膀胱癌における RNA 修飾酵素 AlkB homolog 8 の機能、口頭、大塩郁幹，上田裕子，長谷拓明，北惠郁緒里，神宮司健太郎，島ノ江知樹、趙雨桐，里章平，藤井晋太郎，藤田和利，植村元秀，野々村祝夫，辻川和丈、日本薬学会第 137 年会、2017/3/25、国内

- (3) 「国民との科学・技術対話社会」に対する取り組み

1. 辻川和丈、大阪大学構造展開ユニットの始動、生産と技術、2016, 68,79-82

- (4) 特許出願

無し