



教授 赤井 周司

教授 赤井 周司 Professor
准教授 澤間 善成 Associate Professor
助教 鹿又 喬平 Assistant Professor

Shuji AKAI
Yoshinari SAWAMA
Kyohei KANOMATA

06-6879-8210 akai@phs.osaka-u.ac.jp
06-6879-8212 sawama@phs.osaka-u.ac.jp
06-6879-8213 kanomata@phs.osaka-u.ac.jp

医薬品の殆どは有機化合物である。また、生命現象は大小様々な有機化合物が関与する化学反応から成り立っている。生命現象を分子レベルで考察し、そこから新しい医薬品候補化合物を創製する過程に於いて、有機化合物を扱う「有機化学」の果たす役割は実に大きい。

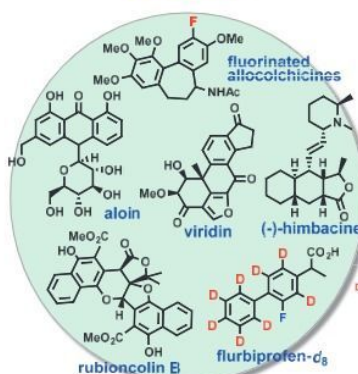
我々は、有機化学を基盤として、新薬候補化合物や、創薬・医療に役立つ高機能性有機化合物の創出を目指して研究を行っている。医薬品の構造が複雑化してきた今日、標的となる化合物の効率的合成のためには新しい概念による合成法や技術、触媒の創生が不可欠である。また、原料となる資源の有効利用、副産物による環境問題、さらには、鏡像異性体の選択的の不斉合成法など、未解決の課題に我々の英知を結集し、独自の解決策を創造することにも注力している。

具体的には、特異な化学構造と顕著な生物活性を有する allocolchicine, aloin, rubioncolin B などの全合成とそれらの誘導体の創製研究を行っている。そのために、「典型元素」、「遷移金属」、「酵素」、「ナノ材料」などを活用し、また潜在能力を引き出し、更にこれらを融合した新しい合成手法を開発している。例えば、「加水分解酵素リパーゼと固定化金属触媒を組み合わせた不斉合成法」、「C-D 結合は C-H 結合より安定であるという同位体効果を利用した生物活性化合物の重水素置換法の開発と生命現象解明への応用」、「芳香族化合物への位置選択的フッ素導入法」、「高反応活性なベンゼインの反応性制御による多置換縮環芳香族化合物の合成法」、「Pickering エマルジョンを反応場とする連続触媒反応の創生と医薬品骨格分子群の合成」、「最先端の計算手法を活用する反応解析や反応設計」などに関する研究を行っている。これらの研究成果で特許を取得し、国際的な専門誌に成果発表を

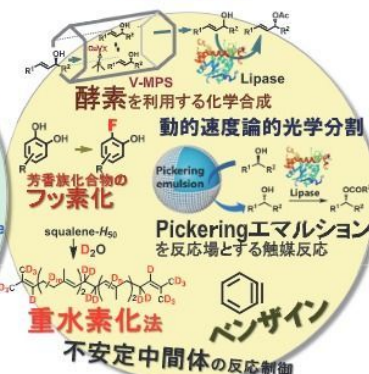
行い、世界的に高い評価を得ている。さらに、我々が合成した新規な医薬品候補化合物、独自の触媒や合成手法などを新薬候補分子の創出、医農薬の効率的製造、革新的医療に繋げるべく、産官学の研究グループとの共同研究を積極的に行っている。

赤井周司教授、澤間善成准教授、鹿又喬平助教は、それぞれ異なるバックグラウンドと得意分野を持っている。各々の知識と経験を活かし、融合し、学生と共に種々の研究課題について日夜研究に励んでいる。

生物活性化合物の合成



新しい合成法や触媒の創出



研究課題

- 1) 生物活性化合物の合成
- 2) 酵素触媒不斉合成法の開発
- 3) 同位体置換法の開発と生命現象解明への応用
- 4) Pickering エマルジョンを反応場とする触媒反応の開発
- 5) 創薬や医療に資する新規機能性分子の精密有機合成

最近の主要論文

1. S. Akai et al., Enantiodivergent Chemoenzymatic Dynamic Kinetic Resolution: Conversion of Racemic Propargyl Alcohols into Both Enantiomers. *Chem. Eur. J.* **2022**, 28, e202202437.
2. S. Akai et al. Lipase-Catalyzed Dynamic Kinetic Resolution of C1- and C2-Symmetric Racemic Axially Chiral 2,2'-Dihydroxy-1,1'-biaryls, *Angew. Chem. Int. Ed.*, **2018**, 57, 10278.
3. S. Akai et al., Diversity Oriented Synthesis of Allocolchicinoids with Fluoro and/or Oxygen Substituent(s) on the C-Ring from a Single Common Intermediate. *Eur. J. Org. Chem.*, **2016**, 1562.
4. S. Akai et al., A Mesoporous-Silica-Immobilized Oxovanadium Cocatalyst for the Lipase-Catalyzed Dynamic Kinetic Resolution of Racemic Alcohols. *Angew. Chem. Int. Ed.*, **2013**, 52, 3654.
5. Y. Sawama et al., Copper-Catalyzed Aqueous N-O Bond Cleavage of 2-Oxa-3-Azabicyclo Compounds to Cyclic cis-1,4-Amino Alcohols. *ChemSusChem*, **2020**, 13, 5632.
6. Y. Sawama et al., Copper-Catalyzed Pyrrole Synthesis from 3,6-Dihydro-1,2-oxazines. *Green Chem.*, **2018**, 20, 4409.
7. Y. Sawama et al., Highly-Functionalized Arene Synthesis Based on Palladium on Carbon-Catalyzed Aqueous Dehydrogenation of Cyclohexadienes and Cyclohexenes. *Green Chem.*, **2018**, 20, 1213.
8. Y. Sawama et al., Efficient Generation of ortho-Naphthoquinone Methides from 1,4-Epoxy-1,4-dihydronaphthalenes and Their Annulation with Allyl Silanes. *Angew. Chem. Int. Ed.*, **2013**, 52, 1515.
9. K. Kanomata et al., Lignin-Inspired Surface Modification of Nanocellulose by Enzyme-Catalyzed Radical Coupling of Coniferyl Alcohol in Pickering Emulsion. *ACS Sus. Chem. Eng.*, **2020**, 8, 1185.
10. K. Kanomata et al., Mechanism and Origin of Stereoselectivity in Chiral Phosphoric Acid-Catalysed Aldol-type Reactions of Azlactones with Vinyl Ethers. *Chem. Eur. J.*, **2020**, 26, 3364.
11. K. Kanomata et al., Cooperative Catalysis of Cellulose Nanofiber and Organocatalyst in Direct Aldol Reactions. *Sci. Rep.*, **2018**, 8, 4098.
12. K. Kanomata et al., Secondary Stereocontrolling Interactions in Chiral Brønsted Acid Catalysis: Study of a Petasis-Ferrier-type Rearrangement Catalyzed by Chiral Phosphoric Acids. *Chem. Sci.*, **2014**, 5, 3515.