よって引き起こされる感染症に対する人 これまでに開発された抗菌薬は細菌に ◆ボトロマイシンA2の全合成 北里生命研、 長井賢一郎氏) (発表

べ大幅 きた。

化)するようになり、ヒトと細菌との戦 菌薬という武器に様々な形で抵抗(耐性 類の強力な武器であり、 大な貢献をしてきた。しかし、細菌も抗 細菌感染症に多

ている。 や化学構造を持つ抗菌薬が常に求められ いはいまだに終わることなく続いてい そしてそのために、新しい作用機序

れるボトロマイシンA2が既存の 北里研グループは、 放線菌から生成さ

Science News 品開発に必須であるとの観点か の関係を詳しく調べることが医薬 菌に対して強力な抗菌活性を示す 抗菌薬の化学構造とは全く異な ロマイシンA~の構造と抗菌活性 ことを再発見した。今回は、ボト 耐性ブドウ球菌を含むグラム陰性 また毒性を示さずメチシリン

という新たなカテゴリ 非天然型誘導体のデザイン、合成、 合成にチャレンジ、計算化学と天 症治療においてボトロマイシン系 抗菌活性試験が可能となり、 全合成に成功した。これにより 然物の分解実験を駆使して、初の を持つボトロマイシンA~の化学 新規な構造と強力な抗菌活性 ーの開発が 感染

体を用いる触媒的不斉アミノ化反 ◆新規ランタノイド ーアミド錯

進むとみられる。

演

鏡像関係にある2つの化合物のうち一方 応によるAS―3201の不斉合 現在使用されている医薬品において、 (同=東大院薬、益子智之氏)

あるいは副作用をもたらすということが は有効であるがもう一方は薬効がない、

(週

る。実際、糖尿病合併症の1つで手足の 結合を高い選択性で作り出すことができ ることに成功した。この触媒を用いると、 これまでの触媒が苦手としていたC-N 性の高い医薬品を提供するには、いかに **育格に持つ化合物から新たな触媒をつく 맫媒を用いる方法である。** はるが、その際、最も効率的なのが不斉 よくある。したがって、薬効および安全 して片方だけを選択的に作るかが重要と びれといった神経障害の治療薬として 発表者らは今回、ランタンとバリンを

第3種郵便物認可

景、社会的貢献などを展示するコーナーも設置されることとなった。 の試みとして講演ハイライトとして選択された成果の内容や研究の背 会では例年通り、薬学会各賞の授賞式が行われる。さらに今回は、初 63題)およびポスター(2907題)の形式で発表される。 また総 究成果を発表する一般演題が過去最高の3770題を記録、口頭(8 ろ、従来合成法による収率(50%)に比 臨床応用が期待されている化合物ラニレ スタットの製造にこの触媒を試したとこ (99%) にアップさせることがで

一る。この病気は、骨強度の低下により骨 患者数は増加の一途をたどるとみられ 後一層の高齢化が見込まれる現在、その 症治療効果(同=北陸大薬、高橋達雄氏) 00万人を超えると推定されており、 わが国における骨粗鬆症患者数は10 ◆粉防已成分テトランドリンの骨粗鬆 4

知ることになる。 る。骨粗鬆症には自覚症状がほと り、骨折による2次的な骨格変化 いってそこで初めて自分の病気を めて困難で、多くは骨折で病院に は慢性腰痛や寝たきりの原因とな 折の危険性が増加するものであ んどなく、その発症を知るのは極

とを見いだした。骨粗鬆症のモデ のことが証明された。骨粗鬆症に 常に保つ細胞に対する作用からそ ルマウスを用いた実験や骨量を正 用されている生薬の1つである粉 が非常に有効な手段であると考え 骨を健全で丈夫な状態に保つこと 日常的に摂取できる生薬によって よる骨折を予防するには、 粗鬆症に対する治療効果を持つこ 防已の主成分テトランドリンが骨 発表者らは、中国で古くから使 個人で

発表者らは、

講 ル・モレキュールの創製(同=東京 を標的としたCD4ミミック・ス ◆H−V侵入の動的超分子機構

医歯大生体材料工学研、山田裕子氏)

現在のHIV感染症およびエイズの治

が注目されている。 なってきており、この侵入段階の阻害剤 カニズム(動的超分子機構)が明らかに 題点もある。最近、HIVがヒトの細胞 効かないウイルスが出現するといった問 功を収めているが、副作用がある、薬の 治療法が主に用いられており、多大な成 み合わせて用いるHARRTと呼ばれる 侵入した後に作用する薬を2、3種類組 療に関しては、患者の細胞内にHIVが に侵入する際に様々な分子が作用するメ

してきたが、今回は侵入の際に最初にH

発表者らは、種々の侵入阻害剤を創製

- Vが結合するヒト細胞表面タンパク質

良好な放射能集積コント

薬剤投与後早期から、癌 法を用いることを計画し 相互作用を利用したプレ トアビジンとビオチンの た。この問題を改善する

が関与していること かなど重要な問題は未解決のままであ 関わっているかどう のの、病態の誘導に とはわかっているも 果として作られるこ ルの多くは病態の結 かし、フリーラジカ が知られている。 上野和徳氏) スクリーニング系の構築(同=日本薬大、 LCによるリポキシゲナーゼ不活性化剤 にはフリーラジカル 酸化ストレス障害

ボンを陽性対照として、新規ラジカル捕 と考えられる。 薬やサプリメントの創製に道を拓くもの 築した。この方法は、新規機序に基づく 捉剤開発のためのスクリーニング系を構 捕捉剤であるプロブコールおよびエダラ を抑制することが知られているラジカル かった。この結果に基づき、これら障害 カルが標的ラジカルとなり得ることがわ ゼと複合体を形成した脂肪酸アリルラジ の誘導の主要酵素であるリポキシゲナー が、評価法を工夫した結果、これら障害 化できるラジカル種の特定を試みてきた ジカルのうち、ラジカル捕捉剤で不活性 性再灌流障害)の誘導に関わるフリーラ

紘平氏) どの悪性度を鑑別することが肝要とな 結合型マトリックスメタロプロテアーゼ ◆プレターゲティング法を用いる、膜 には癌の存在診断だけでなく、転移能な 質の高いテーラーメード医療を実現する 転移・浸潤であるため、効果的な治療、 放射性薬剤の開発 (同=京大院薬、 $\widehat{\mathbb{H}}$ 癌治療を困難にしている最大の原因は - MMP)標的癌悪性度診断用 -MMPは癌細胞膜表面に発 佐野

が示唆された。 面タンパク質の構造変化を起こし、 も見つかった。また、これらを中和抗体 な工夫を加えたものの中に高活性のもの 明らかになり、NBD-556に構造的 D4ミミックの阻害剤としての有用性が どの併用効果を検討した。その結果、 動的超分子機構への影響や、中和抗体な D4ミミックの合成およびHIV侵入の CD4に着目、そのミミックであるNB -556を取り上げ、さらに有用なC

C

イメージを得るには長時

を示してきた。しかし、

MMPを標的とした非侵 てその高い腫瘍集積性を

-ジングによる癌の悪性

し、担癌マウスでの体内

アランスは比較的遅いこ

抗体が認識しやすいようにしていること って、CD4ミミックは侵入に関わる表 されることがわかった。今回の成果によ と併用することで抗ウイルス活性が増強 ◆カラムスイッチングセミミクロHP 中和 炎症時における脳内ST が示された。 とした短時間での癌悪性 ることがわかり、MT1

して全身に感染し急激に

敗血症は、身体内の細

(同=星薬大薬、榎本紗

◆敗血症モデルマウス

 \times

動脈硬化や脳梗塞(虚血 の増加によって、視床下 起こす病態であり、 含めて全身性に爆発的に 機能を有する炎症性サイ った。その結果、全身性 とんど明らかにされてい 器不全に至る。敗血症は 傷を受けた負傷者の急激 モデルマウスを作製し、 目的として、 神症状や脳症発症のメカ 能障害に及ぼす影響の詳 知られているが、全身性 障害を呈すると死亡率が 因としても知られ、 に陥る。また、事故や災 発表者らは、全身性炎 盲腸結紮穿 進行 重篤

東京理大薬、 ナノテクノロジーは、 ーゼル排ガス微粒子の ◆培養細胞におけるナ 酸化チタン、カーボ 小松朋子氏

をハジメ環境・エネルギ

えられる。

う脳症に移行するときの

ることが明らかになった

ルであるSTAT3活性

幹部において細胞内サイ

性炎症が急激な体温変化