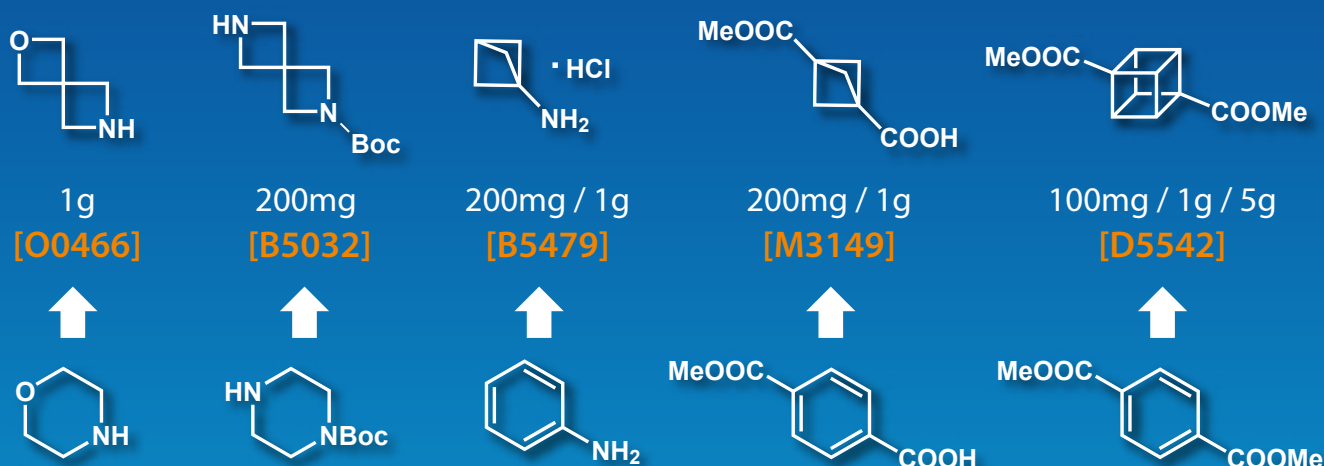


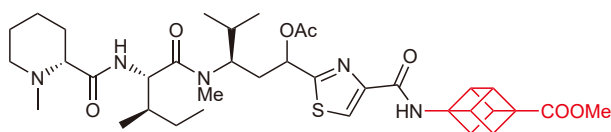
創薬研究用の生物学的等価体 となるビルディングブロック



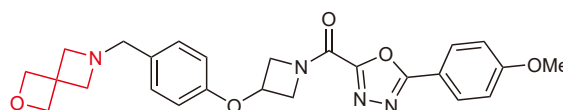
クロスカップリング反応による多くの平面性の高い医薬候補化合物が開発されてきましたが、臨床試験においてはドロップ率が高いことが報告されており、難水溶性に起因する好ましくない体内動態や毒性が原因と推測されています¹⁾。オキサタンを含むO0466はモルホリン環の²⁾、アゼチジンを含むB5032はピペラジン環の³⁾、ビスシクロ[1.1.1]ペンタンを含むB5479・M3149やキュバンを含むD5542はベンゼン環の^{3,4,5)}、生物学的等価体(バイオイソスター)とみなせます。これらのビルディングブロックの導入により、 sp^3 性向上による平面性の打破、水溶性改善、3次元的な置換基伸長が期待できます。

利用例

Tubulin polymerization inhibitor (tubulysin analog)⁵⁾



Melanin concentrating hormone receptor 1 (MCHR1) antagonist⁶⁾



- 引用文献 1) F. Lovering, J. Bikker, C. Humblet, *J. Med. Chem.* **2009**, *52*, 6752. <https://doi.org/10.1021/jm901241e>
 2) G. Wuitschik, M. Rogers-Evans, K. Müller, E. M. Carreira, *et al.*, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2008**, *47*, 4512. <https://doi.org/10.1002/anie.200800450>
 3) J. Burkhard, E. M. Carreira, *Org. Lett.* **2008**, *10*, 3525. <https://doi.org/10.1021/ol801293f>
 4) J. M. Lopchuk, P. S. Baran, *et al.*, *J. Am. Chem. Soc.* **2017**, *139*, 3209. <https://doi.org/10.1021/jacs.6b13229>
 5) T. A. Reekie, C. M. Williams, L. M. Rendina, M. Kassiou, *J. Med. Chem.* **2019**, *62*, 1078. <https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.8b00888>
 6) A. Johansson, *et al.*, *J. Med. Chem.* **2016**, *59*, 2497. <https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.5b01654>

上記以外のビルディングブロックについても取り揃えています。各製品の詳細はTCIのウェブサイトへ ▶▶▶

TCI ビルディングブロック

東京化成工業株式会社

試薬製品について

■本社営業部 〒103-0001 東京都中央区日本橋小伝馬町 16-12 T-PLUS 日本橋小伝馬町8階
Tel: 03-3668-0489 Fax: 03-3668-0520 E-mail: Sales-JP@TCIchemicals.com

■大阪営業部 〒541-0041 大阪府大阪市中央区北浜1-1-21 第2中井ビル1階
Tel: 06-6228-1155 Fax: 06-6228-1158 E-mail: osaka-s@TCIchemicals.com

スケールアップ、受託サービス(合成・開発・製造)について

□化成品営業部 〒103-0001 東京都中央区日本橋小伝馬町 16-12 T-PLUS 日本橋小伝馬町8階
Tel: 03-5651-5171 Fax: 03-5640-8021 E-mail: finechemicals@TCIchemicals.com

弊社製品取扱店

本誌掲載の化学品は試験・研究用にのみ使用するものです。化学知識のある専門家以外の方のご使用はお避けください。品目や製品情報等、掲載内容の変更を予告なく行う場合があります。内容の一部または全部の無断転載・複製はご遠慮ください。