

## 4 8 化学分野3 「創薬を支える有機化学」

### (1) 研究開発の概要

有機化学の学習をしている生徒にとって、身の回りに溢れる有機化合物に触れさせることで、我々の生活との関係を実感することは比較的容易である。しかし「薬」と結びつけて考える機会は、さすがにほとんど無いのではないかと。

この特別研究では、名古屋工業大学の柴田哲男助教授による講義「創薬を支える有機化学」をメインにして、有機化学が創薬に寄与してきた具体例を知ること、有機化学の重要性を認識させるとともに、薬学部以外に拡がりつつある薬学研究の一端を知ること、その一翼を担う人材の輩出につなげることを考えた。

### (2) 研究開発の経緯

#### ア 仮説（ねらい、目標）

昨年度の末に、SSHの連携先である名古屋工業大学に対して、有機化学の講義をお願いしたところ、生命物質化学科の柴田哲男助教授をご紹介いただいた。

柴田先生のご専門が薬学研究であることから、本校の担当者との数回の打ち合わせの結果、講義の内容、講義に先立つ事前授業の内容、講義後の実験の内容を決定した。この特別研究のねらいとしては、以下の3つを考えた。

- (ア) 薬を通して、有機化学の面白さや重要性を認識させる。
- (イ) 薬の研究が、理学部や工学部の研究対象であることを認知させる。
- (ウ) 実際の実験を通して、有機化合物の構造変化を実感させる。

#### イ 研究の方法および内容

- (ア) 対象生徒 2年理系生徒全員（約220名）
- (イ) 実施日時 平成17年12月
- (ウ) 実施内容

この特別研究は3部構成になっている。

##### a 事前講義について

今回の講義の内容は、ペニシリンを中心とした抗生物質の作用機序を通して、創薬における有機化学の重要性を認識させることになっている。そのためにペニシリンの構造を理解させることが事前に必要となった。

そこで以下のような、生徒にとって未習の知識が必要となった。

- アミノ酸の基本構造
- アミノ酸におけるDとL
- L-システインとD-バリンの構造
- 抗生物質とは何か
- ペニシリンの構造（とくにβ-ラクタム環）
- ペニシリンの作用

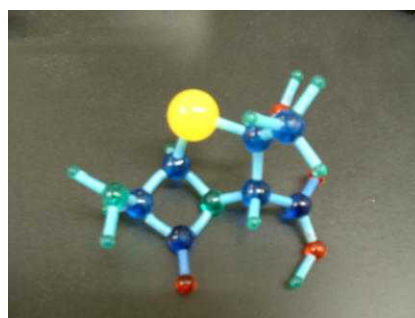
対象となる生徒は、昨年度に野依良治先生の講演を聴いているので、光学異性体に関しては分かっている者が多い。そこで野依講演の事前授業で用いたスライドを利用し、アミノ酸の説明を付け加えることにした。

またモルタルウを用いて、バリンやシステインを各自で作製し、そのDとLを確認した。さらにバリンとシステインを用いて、ペニシリン骨格であるβ-ラクタム環とチアゾリジン環を作製した。このときにβ-ラクタム環を作るときに、正四面体方向の結合を強く歪ませないと4員環ができないことを実感させた。

その後で、理科ネットワークのデジタル教材を用いてペニシリンの作用機序をCGで示した。



アミノ酸分子を組み立てる



作成したペニシリン骨格

b 柴田哲男助教授による講義「創薬を支える有機化学」  
薬とはどんな働きを持つ物質なのか

薬の分子をバスケットボールとすると、人間の細胞が学校の校舎、人体の大きさが地球に相当する。薬とはバスケットボール大の分子が、地球全体に影響を与えるという強力な作用を示す物質である。



柴田哲男先生

ペニシリンの発見

1928年にフレミングによって発見されたペニシリンが、10年後になって感染症の研究をしていたフローリー、チェーンにより重要性を認識され、多くの命を救う薬剤開発の道が開けた。

ペニシリンの作用機序と耐性菌との戦い

細菌が - ラクタマーゼを使ってペニシリンを壊してしまうことを説明する中で、抗生物質と耐性菌との戦いの重要性を指摘した。メシチリン耐性黄色ブドウ球菌などの院内感染の問題や、最近になって問題化したバンコマイシン耐性の細菌の出現などにも関心を持つ必要がある。その耐性菌に対して、薬の構造を変化させて対応するためには、有機化学の知識が不可欠である。

その他の薬について

胃潰瘍の薬がCMでも流れているが、H<sub>2</sub>ブロッカーと呼ばれる薬も有機化学の技術を使って作られた化学物質である。薬の分子が胃酸分泌の指令を出す箇所（受容体）にフタをすることで、胃酸の分泌が抑えられる。

この薬ができる前は、胃潰瘍の治療は胃の切除しかなかった。このように薬は人類にとって必須不可欠なものだが、まだまだウイルスや癌に対する完全な薬剤はできてはいない。これからも研究を進めていく必要がある。

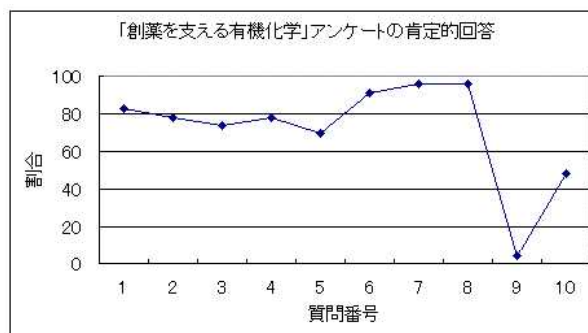
(3) 検証（生徒のアンケート結果より）

アンケートの結果を右に示す。事前実験や講義の理解や興味に関しては、非常に高いものになった。

今回の講義は、化学分野における有機化学の重要性を「薬」という身近な化学物質から認識させることをねらいとしている。興味や関心の高さは、それが達成されたことを示している。

なお質問9は「工学部で薬学研究が行われていることを知っていましたか？」という問いで、予想どおり低い値になった。これも今回の講義のねらいであり、次世代の薬学研究は従来の薬学部中心から他の学部学科への移行時期であることを認識できた。

そうした現状を知り、なおかつ有機化学の重要性を認識できた今回の講義は、非常に意義があったと思われる。



(4) 成果と反省

ア 事業実施による成果

本事業は高等学校の化学の内容で、生徒には難しい部分もあった。しかし柴田先生と事前学習の内容まで踏み込んだ打ち合わせの結果、生徒の高い理解と関心を引きつけることができた。また2年終了時のアンケートでも、柴田先生の講義が興味深かったと答える生徒が多く見られ、「葉」をテーマにした有機化学の教材が生徒にとって非常に効果的であることが示された。

イ 今後の課題

今回の事業は、本来は「事前授業、講義、実験」の3つの内容を予定していたが、日常の学習とのつながりを優先したため、実験を行う時期が大幅に遅れることとなった。そのため講義との関連性を持たせることができなくなり、結果的に通常の有機実験であるサリチル酸メチルやニトロベンゼンの合成実験を実施することしかできなかった。

来年度のSSHでは、ここで実施できなかった有機実験を分子軌道法の実習と関係させて実施することを構想している。実際の物質を観察することの重要性を考え、次年度以降の反省としていきたい。