

# 創薬の不可能を可能にする 中分子ペプチド医薬

低分子と抗体の利点を兼ね備えた新モダリティで  
活性化・機能阻害・分子間相互作用を自在に操る!

序にかえて ペプチド創薬と治療薬開発のさらなる進展に  
期待する! .....菅 裕明

総論

中分子ペプチド医薬の歴史と展望

—中分子ペプチド医薬が明日の医療を拓く.....玉村啓和 10 (144)

## 第1章 新規ペプチドの設計・合成・探索

### I. 設計

1. *In vitro*における遺伝暗号リプログラミング技術.....平嶋瞭一, 加藤敬行 19 (153)
2. 天然物ペプチドを真似た人工ペプチド: 擬天然ペプチド薬剤の創製  
.....後藤佑樹 27 (161)
3. 天然由来二環式ペプチドを基盤とする医薬品分子設計  
.....永澤秀子, 小池晃太, 山田晴輝, 辻 美恵子 35 (169)

### II. 合成・展開

4. 脱保護工程を挟まない高効率フローペプチド合成.....布施新一郎 43 (177)
5. ペプチドを基盤とした標的タンパク質光不活化とその医薬展開  
.....谷口敦彦, 林 良雄 50 (184)
6. タンパク質の機能を制御する環状ペプチドの合成・探索.....村田陽二 56 (190)

<b>7. 均一糖鎖構造をもつ糖タンパク質の精密合成と機能解析</b>	平尾宏太郎, 真木勇太, 梶原康宏	64 (198)
-------------------------------------	-------------------	----------

<b>8. 副反応を出発点とするペプチド側鎖修飾反応</b>	大高 章	71 (205)
--------------------------------	------	----------

<b>9. ペプチド系複雑天然物の全合成とその応用展開</b>	伊藤寛晃, 井上将行	78 (212)
---------------------------------	------------	----------

## Ⅲ. 探索・シミュレーション

<b>10. 中分子ペプチド医薬の膜透過性予測</b>	秋山 泰	85 (219)
-----------------------------	------	----------

<b>11. ペプチドライブラリー構築と機能性分子の探索</b>	大河内美奈	92 (226)
----------------------------------	-------	----------

## 第2章 薬理活性の創出

<b>1. 代謝調節に関連する生体ペプチドを基軸とした創薬研究</b>	高山健太郎	98 (232)
-------------------------------------	-------	----------

<b>2. マイトクリプタイドと急性炎症治療を指向した革新的創薬</b> —新規自然免疫トリガー因子の発見と難治性組織傷害治療への適用	向井秀仁	104 (238)
--	------	-----------

<b>3. 人工抗体の開発</b>	梅本 駿, 村上 裕	113 (247)
-------------------	------------	-----------

<b>4. 環状ペプチドに基づくサイトカインミメティクス</b>	酒井克也	121 (255)
----------------------------------	------	-----------

<b>5. ユビキチンを用いたラソグラフト分子改良の新戦略</b>	今井幹雄, 菅 裕明	128 (262)
-----------------------------------	------------	-----------

## 第3章 デリバリー・膜透過改善への取り組み

<b>1. 膜透過・経口吸収可能な環状中分子ペプチドの創薬展開</b>	太田 淳, 木村香緒梨	135 (269)
-------------------------------------	-------------	-----------

<b>2. 生理活性ペプチドのDDS</b>	勝見英正	144 (278)
------------------------	------	-----------

**3. 受動的に膜を透過するペプチド型中分子**

—環状ペプチドとペプトイド.....森本淳平 151 (285)

**4. 局在性小分子・ペプチドによるタンパク質局在制御**

.....築地真也, 王 笑桐 157 (291)

**5. 小腸吸収・脳関門透過を促進する DDS キャリア**

.....伊藤慎悟 165 (299)

**第4章 疾患治療への応用・将来の創薬への課題**

**1. 骨形成・骨再生を促進するペプチド医薬**

.....久保優里, 陳徳容, 謝倉右, 青木和広 171 (305)

**2. ナトリウム利尿ペプチドとペプチド医薬**

.....小川治夫, 古谷真優美, 錦見俊雄, 南野直人 179 (313)

**3. 進化する2型糖尿病・肥満症に対するペプチド創薬**

—GIP/GLP-1 デュアルアゴニストの登場.....安田拓真, 池口絵理, 矢部大介 188 (322)

**4. 中分子ペプチド医薬品の規制ガイドラインの現状と課題・展望**

.....出水庸介 197 (331)

索引..... 203 (337)