

SS03-4 核内受容体リガンドの論理的創製を目指して；PPARを例に

○宮地 弘幸¹

¹岡山大院医歯薬

近年、医薬の創製成功確立が大変小さくなってきていることは諸兄のお気づきの通りである。開発最終段階でのドロップアウトもさることながら、質の良いリード化合物発見の過程においても該当する化合物が見出し難くなっているのが現状である。知的に洗練されたリード化合物を得るために創薬研究者は凌ぎを削っている。しかし先人も言っているように、創薬に王道は（多分）ない。ハイスループットスクリーニングによる絨毯爆撃的手法の限界が明らかとなった今日、化合物ライブラリー構築-化合物合成-薬効評価-分子モデリング解析-X線結晶構造解析という各創薬リソースの統合究がますます重要になってきたと著者は考えている。本シンポジウムにおいてはアカデミアにおいて著者が数年来続けてきた、より高活性、より選択性をキーワードに進めてきた核内受容体 PPAR のサブタイプ選択的リガンド創製研究を例にして、この統合研究の意義を諸兄と考えてみたい。