

課題番号	研究課題名	研究代表者	評価結果
15109001	ヘテロ元素含有高次構造天然物の独自の合成法の開発	福山 透 (東京大学・大学院薬学系研究科・教授)	A+
<p>ヘテロ元素含有天然物には重要かつ特異な生物活性を持ち、医薬品シーズとして期待されるものが多い。近年の有機合成化学の発展は目覚ましいが、未だその力量は真に物質供給という意味では充分とはいえず、新薬創製の基盤となる天然物合成の力量を更に高めることが強く望まれている。本研究では、独自に開発した合成方法論および高い独創性を持つ効率的な合成デザインによって、真に物質供給に耐えうる全合成法の開発を目的として、ヘテロ元素含有高次構造を持つ各種生物活性天然物の合成研究を遂行した。</p> <p>その結果、自ら開発した芳香族アミノ化反応を用いて抗腫瘍活性物質デュオカルマイシンおよびヤタケマイシンの全合成、不斉 CH 挿入反応によるジヒドロベンゾフラン環合成法およびNs-戦略によるエフェドラジンおよびセロトベニンの全合成、インドール合成法および中員環合成法を用いてストリキニーネ、コノフィリン、およびアスピドフィチンの全合成、また独創的合成デザインによる新規免疫抑制物質 FR901483、インフルエンザ特効薬タミフル、リゼルグ酸、鎮痛薬モルヒネの効率的な全合成を達成した。実際に、ヤタケマイシン、タミフルなど合成した天然物は、生物活性試験に供給されている。これらの成果は、いずれも独自に開発した合成法を効果的に用い、独創性の高い合成デザインのもと、かつ効率性の高い全合成であり、64 報もの論文として権威の高い学術雑誌に発表されている。</p> <p>これらの目覚ましい成果は、当初の研究目的を十分に達成していると評価できる。研究代表者は、2004 年度アメリカ化学会賞、2006 年度日本薬学会賞を受賞しており、本研究成果の学術的高さは国内外で極めて高く評価されている。本研究成果は、有機合成化学分野への貢献のみならず、創薬化学・プロセス化学・ケミカルバイオロジー分野など関連分野への波及効果が極めて高い。</p>			