

科学研究費助成事業（基盤研究（S））研究進捗評価

課題番号	16H06384	研究期間	平成28(2016)年度 ～令和2(2020)年度
研究課題	糖ペプチドを含有する大・中分子の合成を指向した革新的合成触媒の開発	研究代表者 (所属・職) (令和4年3月現在)	竹本 佳司 (京都大学・薬学研究科・教授)

【令和元(2019)年度 研究進捗評価結果】

評価	評価基準
A+	当初目標を超える研究の進展があり、期待以上の成果が見込まれる
○ A	当初目標に向けて順調に研究が進展しており、期待どおりの成果が見込まれる
A-	当初目標に向けて概ね順調に研究が進展しており、一定の成果が見込まれるが、一部に遅れ等が認められるため、今後努力が必要である
B	当初目標に対して研究が遅れており、今後一層の努力が必要である
C	当初目標より研究が遅れ、研究成果が見込まれないため、研究経費の減額又は研究の中止が適当である
<p>(意見等)</p> <p>本研究は、アミノ酸や糖類からなる大・中分子を多量に合成するという有機化学の課題に、新たな触媒や触媒反応を開発し効率的に合成する化学的手法を確立するものである。</p> <p>ペプチド・蛋白の合成法に関して gem-ジボロン酸を触媒とするペプチド結合形成反応は改良すべき点はあるが室温ペプチド合成法への発展が期待できる研究成果である。また、α-ケト-β-アミノ酸と C 末保護アミノ酸との TBHP (tBuOOH) を用いたライゲーション反応もペプチド合成への波及効果が期待できる研究成果である。</p> <p>計画の一部に遅れはあるものの複数の重要な進展が認められており、総じて研究は順調に進展している。今後は当初計画を進めるとともに新規発見部分を展開し、実用性・汎用性の高い方法論を確立することが望まれる。</p>	

【令和4(2022)年度 検証結果】

検証結果	当初目標に対し、期待どおりの成果があった。
A	<p>本研究の目的は、アミノ酸や糖質をもつ大・中分子化合物の有機合成のための新たな触媒を開発し効率的な合成法を確立することである。今回、チオ尿素・ボロン酸触媒を開発し β-³-アミノ酸誘導体の合成、gem-ジボロン酸を用いたペプチド結合形成反応など、ペプチド・タンパクの革新的化学合成法につながる研究成果があった。また、<i>O</i>-及び <i>N</i>-グリコシル化触媒による各種単糖やオリゴ糖の合成、チオ尿素触媒を利用した抗結核薬リード化合物であるカプラザマイシンの全合成に世界で初めて成功するなど、当初目標に対して期待どおりの成果があった。</p> <p>本研究による成果は、大・中分子化合物の効率的な合成に向けた基盤技術の一つとして、今後の医薬品開発において有用である。</p>