

科学研究費助成事業（特別推進研究）研究進捗評価

課題番号	20002004	研究期間	平成20年度～平成24年度
研究課題名	斬新かつ实用性を追求した生体機能分子の合成研究		
研究代表者名 (所属・職)	福山 透 (名古屋大学・大学院創薬科学研究科・特任教授)		

【平成23年度 研究進捗評価結果】

該当欄		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
	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

(評価意見)

我が国では、がんなどの難治性疾患の克服に対し新規医薬品の開発に対する期待が極めて大きい。この状況の下で、生理活性を持つ天然物有機化合物の量的供給は極めて重要である。研究代表者は強力な抗腫瘍活性が認められているエクチナサイジン 743 の全合成に挑戦し、L グルタミン酸から 29 工程、収率 1.9% でグラムスケールでの合成を達成している。これは研究代表者の学問的实力、企画力、組織力を明確に示す成果であり、当初目標に向けて順調に研究は進展している。ただし、この到達点でもまだ医薬品製造プロセスとしての実用化は困難であろう。しかし、研究代表者もその点は理解し、改善への方策を立てているので、本研究期間内にはさらなる進展が期待できる。

目的とする天然物有機化合物の合成を通じて研究代表者自身の見出した新反応や新概念を広く公表することにより、期待以上の成果が見込まれるのではないかと期待している。残りの研究期間の研究成果を大いに期待したい。

【平成26年度 検証結果】

検証結果	当初の研究目標として掲げられていた、エクチナサイジン 743、ヒューパジン A、サリノスポラミドの全合成をいずれも達成した。特に極めて複雑な構造と強力な抗がん活性をもつエクチナサイジン 743 の全合成は、以前、研究代表者が報告したルートを大幅に短縮するものであり、大きな成果といえる。また、既存化合物を超える活性を有する誘導体の取得には至っていないものの、ビンブラスチン、オセルタミビル、ユーデストミンの類縁体合成も着実に進んだ。さらに研究の順調な進展に伴って追加した標的化合物であるリゼルギン酸、アマサスピラミドなどの全合成も達成しており、研究は極めて順調に進展したといえる。これらの研究成果は、単に特定の化合物の全合成の達成に留まらず、新反応や新概念の創出も含まれている。広く有機合成化学に寄与し得る研究成果であり、十分な研究成果として高く評価できる。
A	