

科学研究費助成事業（基盤研究（S））中間評価

課題番号	22H04970	研究期間	令和4(2022)年度～ 令和8(2026)年度
研究課題名	巨大複雑天然物の高機能化：全合成・大規模ライブラリー構築・機能分子創製の革新	研究代表者 (所属・職) (令和6年3月現在)	井上 将行 (東京大学・大学院薬学系研究科 (薬学部)・教授)

【令和6(2024)年度 中間評価結果】

評価		評価基準
	A+	想定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	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-	一部に遅れ等が認められるため、今後努力が必要であるが、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
	B	研究が遅れており、今後一層の努力が必要である
	C	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>(研究の概要)</p> <p>本研究は、1) 巨大複雑天然物の高効率な全合成、2) 巨大複雑天然物の大規模ライブラリー化による生物活性機能の向上、3) 質量分析を駆使した微量化合物の構造解析技術の確立、4) 金ナノ粒子への担持による創薬を目指した新たなモダリティ創造という4本の柱を設定し、研究代表者らの世界最先端の合成力を基盤に、全合成を機軸とした天然物化学の次世代へ向かう新たな展開を意図している。</p>		
<p>(意見等)</p> <p>非常に挑戦的な研究計画に対して、後述するとおり期待どおりの研究成果が得られている。高度に官能基化された複雑な多環性構造を持つ生物活性天然物の全合成とその類縁体の設計・合成で卓越した成果を上げている。多数の極性官能基が存在する基質に対して、ラジカル反応や遷移金属触媒を駆使した緻密で独自性が高い合成戦略を編み出し、最高難度の標的分子の全合成を次々に実現している。合成化学の最先端と未踏のケミカルスペースを開拓しながら、非常に挑戦的な研究を展開している。従来よりも工程数を格段に短縮して、生物活性天然物を合成化学的に供給可能とした。また、HIV 潜伏感染細胞を活性化したのちに排除する「Shock and Kill」アプローチにおいて有望な天然物を見いだしている。今後は、研究代表者が開発している巨大複雑天然物の合成プロセスを基盤とすれば、次世代創薬候補となる類縁体ライブラリーが創り出され、合成・分析・計算・ナノサイエンスを統合した創薬科学の新たな展開が期待できる。</p>		