

令和 3 年 6 月 14 日現在

機関番号：17301

研究種目：若手研究

研究期間：2018～2020

課題番号：18K14870

研究課題名（和文）ジ置換アミノ酸を利用した新規ペプチドフォールドマーの設計と合成

研究課題名（英文）Design and synthesis of peptide foldamer using alpha,alpha-disubstituted alpha-amino acids

研究代表者

上田 篤志（UEDA, Atsushi）

長崎大学・医歯薬学総合研究科（薬学系）・准教授

研究者番号：10732315

交付決定額（研究期間全体）：（直接経費） 3,300,000円

研究成果の概要（和文）： $\alpha,\alpha$ -ジ置換アミノ酸の合成とそれらを用いてペプチドを合成し、そのペプチドの二次構造を解析することで、ペプチドフォールドマーとして利用に関する可能性を調べることを中心に研究を行った。フッ素を導入した  $\alpha,\alpha$ -ジ置換アミノ酸の合成では、様々な側鎖を有するものを合成した。これらは(R)-BINOLエステルとすることでジアステレオマーとし、光学分割を行うことに成功した。希少糖タガトースのグリコシル化を用いて、側鎖を希少糖修飾したアミノ酸も合成した。さらにペプチド触媒の構造を簡素化することにより、環状エノンに対する不斉マイケル付加反応を少ない触媒量で高立体選択的に進行させることにも成功した。

研究成果の学術的意義や社会的意義

生体内で重要な役割を担うペプチドは、機能性分子としての高いポテンシャルを有している。今回フッ素を導入したペプチドにより、バイオアベイラビリティの増大が期待でき、また一方で、希少糖を導入したアミノ酸を今後ペプチドへ導入していくことで、生体内リガンドとしての可能性も高まる。ペプチド触媒の簡素化による触媒活性の向上は、化合物のロス減らし、グリーンサステナビリティの向上に資する結果と考えられる。

研究成果の概要（英文）：Synthesis of  $\alpha,\alpha$ -disubstituted  $\alpha$ -amino acids and their peptides were performed. Secondary structural analysis of these peptides could be useful for design of peptide foldamers.  $\alpha$ -Trifluoromethylated  $\alpha,\alpha$ -disubstituted  $\alpha$ -amino acids were synthesized with a variety of side chains. Optical resolution of these amino acids were achieved by chromatographic separation of the corresponding (R)-BINOL ester derivative. We also synthesized  $\alpha$ -amino acids possessing rare sugar on their side chain. Simplification of peptide catalyst structure resulted in high catalytic activity, which is important from the point of green sustainability.

研究分野：化学系薬学

キーワード：ジ置換アミノ酸 ペプチド 有機分子触媒 薬学 有機化学

### 1. 研究開始当初の背景

自然界に存在する L-α-アミノ酸からなるペプチドは、その配座自由度が大きいため、通常そのままでは機能を発現することが困難である。この性質は特に短い残基数からなるペプチドの機能性開発において問題となるため、必然的にコンフォメーションを制御する技術が求められてくる。そのような手法の一つとして、L-α-アミノ酸の α-位水素をアルキル基で置換した、α-置換アミノ酸を利用する方法が知られている。α-置換アミノ酸の多くは非天然のものであり、その効率的な合成法の開発は重要な課題である。また、α-置換アミノ酸を導入したペプチドの合成とその二次構造解析に関してもまだ未踏の事象も多く、今後の機能性開発における重要な課題であると言える。

### 2. 研究の目的

本研究では、鍵となるツールとして、新規に合成した置換アミノ酸を利用することで、ペプチドフォールドマーの構造を高度に制御し、短鎖ペプチドを機能性分子として展開し利用することを目的とする。さらにペプチド配列が自由に変更できる利点を活かして、ペプチドフォールドマーの設計と合成に取り組むことで、チューナブルで実用的なテララーメイド有機分子触媒へと発展させる。

### 3. 研究の方法

α-置換アミノ酸の合成とそれらを用いてペプチドを合成し、そのペプチドの二次構造を解析することで、ペプチドフォールドマーとして利用に関する可能性を調べることを中心に研究を行なった。

フッ素を導入した α-置換アミノ酸の合成とペプチドへの導入さらにそれらの二次構造解析を行なった。近年、フッ素を含有した化合物の医薬品や農薬等の機能性分子における比重は増えており、フッ素を導入したペプチド開発に関しても機能性の増強と将来性が期待できる。

また、アミノ酸側鎖の構造修飾として、グリコシル化によってアミノ酸側鎖に希少糖を導入したアミノ酸の合成についても研究を行った。

さらに、α-置換アミノ酸を導入したペプチドフォールドマーに関して、有機分子触媒としての構造と合成の簡素化に関する研究も行なった。ペプチド触媒 H-Trp<sub>2</sub>-Leu<sub>2</sub>-Ac<sub>5</sub>C-Leu<sub>2</sub>-Ac<sub>5</sub>C-OMe は、α-不飽和ケトンに対するマロン酸エステルの不斉マイケル付加反応を高い立体選択性で触媒することがわかっていたが、合成に多段階を要していた。一方環状エノンに対しては、H-Leu<sub>4</sub>-Ac<sub>5</sub>C-Leu<sub>2</sub>-Ac<sub>5</sub>C-OMe がトリプトファン含有ペプチドよりも高い選択性を示していたことから、このロイシンベースのオクタペプチドを元に、さらなる触媒の簡素化と活性を高める構造修飾を行なった。

### 4. 研究成果

α-トリフルオロメチル化 α-置換アミノ酸の合成に関して、トリフルオロピルビン酸のメチルまたはエチルエステルと、ベンジルカルバメートまたは *tert*-ブチルカルバメートから縮合させてできたイミンに対し、種々の Grignard 試薬を付加させたところ、いずれも高収率で対応する α-トリフルオロメチル化 α-置換アミノ酸を与えた (図 1)。得られた α-トリフルオロメチル化 α-置換アミノ酸はラセミ体であるため、(*R*)-BINOL エステル誘導体へと導くことでジアステレオマーとし、これらをカラムクロマトグラフィーによって光学分割することに成功した (図 2)。次に合成した光学活性 α-トリフルオロメチルアラニンと L-ロイシンからなるヘテロペプチドを合成し、二次構造解析を行なった。CD、IR、二次元 NMR、さらに X 線結晶構造解析を行なった結果、α-トリフルオロメチルアラニンの立体化学がペプチド二次構造へ与える影響は限定的であったものの、高い脂溶性やペプチドカップリングにおいて特徴的な反応性を示すことがわかった (図 3)。今回得られた結果は、α-トリフルオロメチル化 α-置換アミノ酸の側鎖構造の修飾を検討する際や、ペプチドへの導入位置を決定する際に有益な情報であると考えられる。

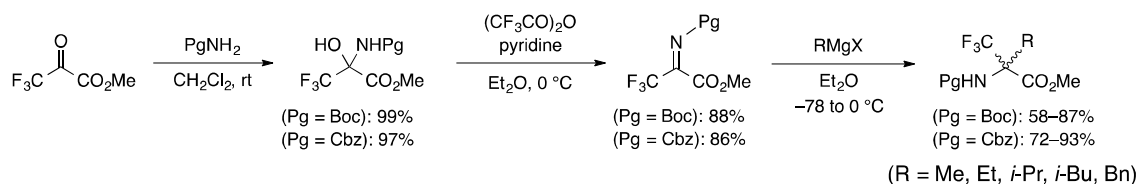
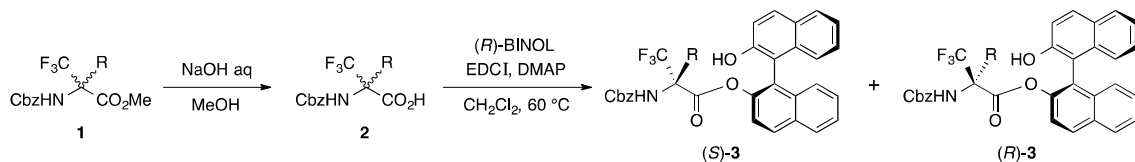


図 1. α-トリフルオロメチル化 α-置換アミノ酸の合成



Entry	SM	R	Product	Yield (%)	Product	Yield (%)
1	<b>1a</b>	Me	<b>2a</b>	85	<b>3a</b>	70
2	<b>1b</b>	Et	<b>2b</b>	92	<b>3b</b>	65
3	<b>1c</b>	<i>i</i> -Pr	<b>2c</b>	75	<b>3c</b>	66
4	<b>1d</b>	<i>i</i> -Bu	<b>2d</b>	78	<b>3d</b>	41
5	<b>1e</b>	Bn	<b>2e</b>	84	<b>3e</b>	30

図 2.  $\alpha$ -トリフルオロメチル化,  $\beta$ -ジ置換アミノ酸の光学分割

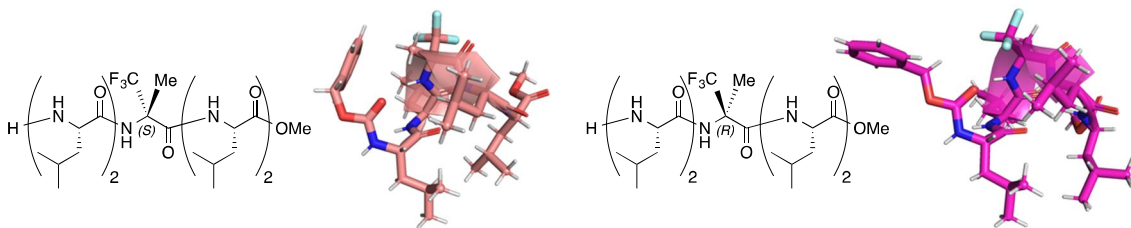


図 3.  $\alpha$ -トリフルオロメチル化,  $\beta$ -ジ置換アミノ酸含有ペプチドの X 線構造

希少糖である D-タガトフラノースの 3,4 位をアセトニドで保護したグリコシルドナーを用いてアミノ酸の側鎖修飾を行なった (図 4)。その結果 Fmoc 保護された L-セリンや Boc 保護された L-トレオニンの側鎖の酸素上に効率的かつ立体選択的に希少糖タガトースを導入することができた。なお開発した D-タガトフラノースのグリコシル化は、アミノ酸以外のグリコシルアクセプターとしてフェノールや L-メントールや D-ガラクトピラノースとも反応可能で、いずれも選択的にグリコシドを与えた。

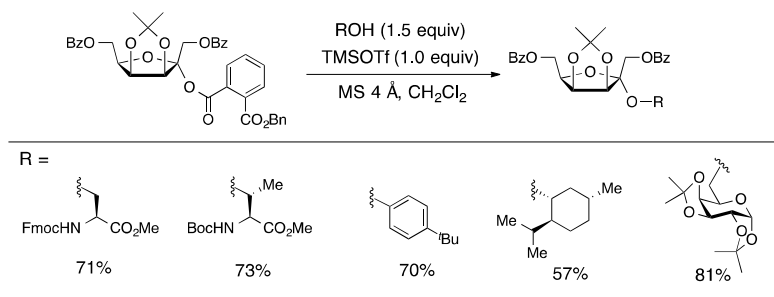
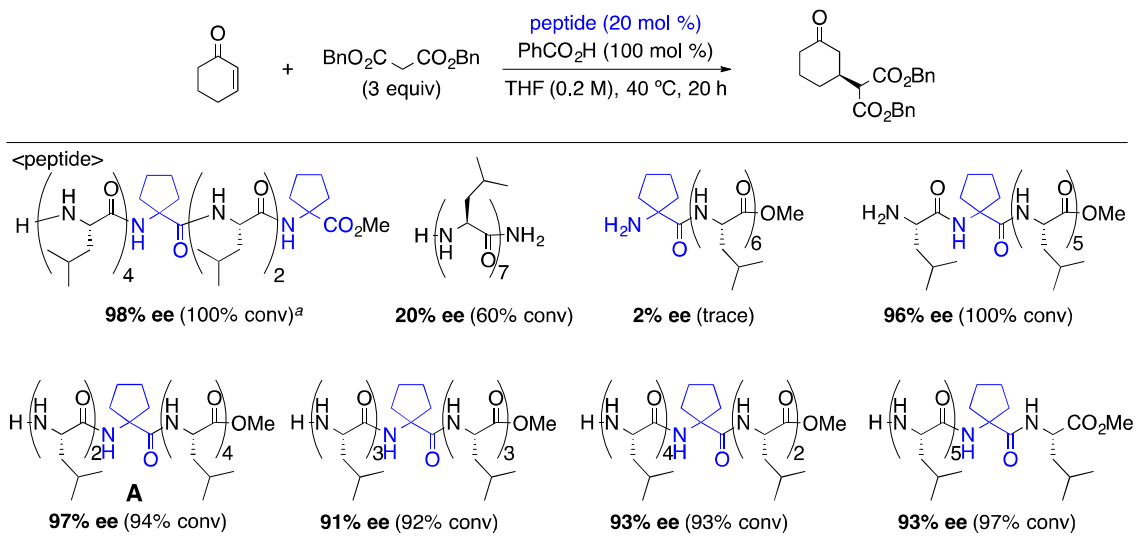


図 4. グリコシル化によるアミノ酸側鎖の希少糖修飾

ペプチド触媒 H-Leu<sub>4</sub>-Ac<sub>5</sub>C-Leu<sub>2</sub>-Ac<sub>5</sub>C-OMe はシクロヘキセンへのマロン酸エステルの不斉マイケル付加反応を高立体選択に触媒した。そこでマロン酸エステル類の環状,  $\alpha$ -不飽和ケトンに対する不斉マイケル付加反応において、触媒の簡素化と基質適用範囲の検討を行なった。まず鍵となる,  $\beta$ -ジ置換アミノ酸である 1-アミノシクロペンタンカルボン酸のペプチドへの導入数を一つまで減らし、その位置を検討した結果、N 末端から 3 あるいは 2 残基目にある位置において、良好な立体選択性を示した (図 5)。その他の構成アミノ酸としてはロイシンを用いることで、わずか 7 残基からなるペプチドで 97% ee の高い立体選択性を実現することに成功した。残基数が短いほど二次構造の制御が難しくなる反面、触媒の合成が簡単になるため、機能性ペプチド開発には重要な知見となりうる。さらに溶媒を種々検討することで触媒量の削減に成功し、わずか 5 mol % での触媒反応を実現した。有機分子触媒開発において触媒量の低容量化が難しいことが問題となることが多いが、その問題に対する一つのアプローチとなることが期待できる。続いてマロン酸ジイソプロピルと各種環サイズの異なる環状,  $\alpha$ -不飽和ケトンとの反応を検討した結果 5 員環、6 員環、7 員環のいずれの場合においても、95-99% ee の高い立体選択性を得ることに成功した (図 6)。小分子触媒での反応では基質のサイズが変わると立体選択性が低下することが問題となるが、この点に関してはペプチド二次構造の利点を活かした触媒開発が行えたといえ、今後のペプチド触媒設計における新たな指針が得られた。



<sup>a</sup> Reaction time: 96 h

図 5 . ペプチド触媒の簡素化

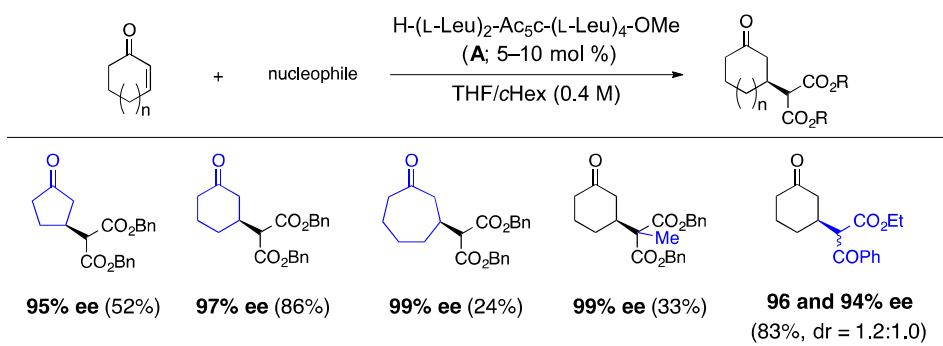


図 6 . 基質適用範囲の検討

## 5. 主な発表論文等

〔雑誌論文〕 計9件（うち査読付論文 9件／うち国際共著 0件／うちオープンアクセス 4件）

1. 著者名 Makura Yui, Ueda Atsushi, Matsuzaki Takashi, Minamino Tetsuo, Tanaka Masakazu	4. 巻 75
2. 論文標題 -Selective glycosidation of d-tagatofuranose with a 3,4-O-isopropylidene protection	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 Tetrahedron	6. 最初と最後の頁 3758 ~ 3766
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.tet.2019.05.052	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -
1. 著者名 Umeno Tomohiro, Ueda Atsushi, Doi Mitsunobu, Kato Takuma, Oba Makoto, Tanaka Masakazu	4. 巻 60
2. 論文標題 Helical foldamer-catalyzed enantioselective 1,4-addition reaction of dialkyl malonates to cyclic enones	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 Tetrahedron Letters	6. 最初と最後の頁 151301 ~ 151301
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1016/j.tetlet.2019.151301	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -
1. 著者名 Ueda Atsushi, Pi Jinhong, Makura Yui, Tanaka Masakazu, Uenishi Jun'ichi	4. 巻 10
2. 論文標題 Stereoselective synthesis of (+)-5-thiosucrose and (+)-5-thioisosucrose	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 RSC Advances	6. 最初と最後の頁 9730 ~ 9735
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1039/d0ra01033b	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -
1. 著者名 Tanaka Masakazu, Yakabi Haruka, Nakatani Haruki, Ueda Atsushi, Doi Mitsunobu, Oba Makoto	4. 巻 72
2. 論文標題 Helical Structures of Cyclopentene-based , -Disubstituted -Amino Acid Homopeptides	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 CHIMIA International Journal for Chemistry	6. 最初と最後の頁 848 ~ 852
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.2533/chimia.2018.848	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Ueda Atsushi, Nishimura Yuri, Makura Yui, Tanaka Masakazu, Uenishi Jun'ichi	4. 巻 97
2. 論文標題 -Selective D-Psicofuranosylation of Pyrimidine Bases and Thiols	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 HETEROCYCLES	6. 最初と最後の頁 729 ~ 729
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3987/COM-18-S(T)42	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Koba Yurie, Ueda Atsushi, Oba Makoto, Doi Mitsunobu, Kato Takuma, Demizu Yosuke, Tanaka Masakazu	4. 巻 20
2. 論文標題 Left-Handed Helix of Three-Membered Ring Amino Acid Homopeptide Interrupted by an N-H . . . Ethereal O-Type Hydrogen Bond	5. 発行年 2018年
3. 雑誌名 Organic Letters	6. 最初と最後の頁 7830 ~ 7834
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1021/acs.orglett.8b03331	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Ueda Atsushi, Tanaka Masakazu, Higuchi Mei, Umeno Tomohiro	4. 巻 99
2. 論文標題 Enantioselective Synthesis of 2,4,5-Trisubstituted Tetrahydropyrans via Peptide-Catalyzed Michael Addition Followed by Kishi ' s Reductive Cyclization	5. 発行年 2019年
3. 雑誌名 HETEROCYCLES	6. 最初と最後の頁 in press
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3987/COM-18-S(F)63	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている (また、その予定である)	国際共著 -

1. 著者名 Ueda Atsushi, Ikeda Misuzu, Kasae Takuya, Doi Mitsunobu, Demizu Yosuke, Oba Makoto, Tanaka Masakazu	4. 巻 5
2. 論文標題 Synthesis of Chiral Trifluoromethyl , Disubstituted Amino Acids and Conformational Analysis of L Leu Based Peptides with (R) or (S) Trifluoromethylalanine	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 ChemistrySelect	6. 最初と最後の頁 10882 ~ 10886
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.1002/slct.202002888	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスではない、又はオープンアクセスが困難	国際共著 -

1. 著者名 Ueda Atsushi、Higuchi Mei、Sato Kazuki、Umeno Tomohiro、Tanaka Masakazu	4. 巻 25
2. 論文標題 Design and Synthesis of Helical N-Terminal l-Prolyl Oligopeptides Possessing Hydrocarbon Stapling	5. 発行年 2020年
3. 雑誌名 Molecules	6. 最初と最後の頁 4667 ~ 4667
掲載論文のDOI (デジタルオブジェクト識別子) 10.3390/molecules25204667	査読の有無 有
オープンアクセス オープンアクセスとしている(また、その予定である)	国際共著 -

[学会発表] 計36件(うち招待講演 1件/うち国際学会 11件)

1. 発表者名 Yui Makura、Atsushi Ueda、Takashi Matsuzaki、Tetsuo Minamino、Masakazu Tanaka
2. 発表標題 alpha-Selective glycosidation of D-tagatofuranose using 3,4-O-isopropylidene protection.
3. 学会等名 The American Chemical Society Fall 2019 National Meeting & Exposition (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Tomohiro Umeno、Atsushi Ueda、Takuma Kato、Mitsunobu Doi、Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Design of helical peptide foldamers for asymmetric reactions.
3. 学会等名 The American Chemical Society Fall 2019 National Meeting & Exposition (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Atsushi Ueda、Mei Higuchi、Tomohiro Umeno、Arisa Sugiyama、Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Helical peptide-catalyzed asymmetric Michael addition reactions of malonates to alpha,beta-unsaturated ketones and their synthetic applications.
3. 学会等名 The American Chemical Society Fall 2019 National Meeting & Exposition (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Misuzu Ikeda, Takuya Kasae, Atsushi Ueda, Makoto Oba, Mitsunobu Doi, Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Synthesis of alpha-trifluoromethyl alpha-amino acids and conformational analysis of their peptides.
3. 学会等名 第56回ペプチド討論会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Kazuki Sato, Tomohiro Umeno, Atsushi Ueda, Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Asymmetric Michael addition reaction using peptide-catalysts with a thiourea moiety.
3. 学会等名 第56回ペプチド討論会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 梅野 智大、上田 篤志、加藤 巧馬、土井 光暢、田中 正一
2. 発表標題 ヘリカルペプチドフォルダマーを利用した不斉触媒反応の開発
3. 学会等名 第45回反応と合成の進歩シンポジウム
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 佐藤 和樹、梅野 智大、上田 篤志、田中 正一
2. 発表標題 ペプチドのN末にチオウレア部位を持つ触媒による不斉1,4-付加反応
3. 学会等名 第36回日本薬学会九州支部大会
4. 発表年 2019年



1. 発表者名 真倉 唯、上田 篤志、上西 潤一、松崎 高志、南野 哲夫、田中 正一
2. 発表標題 立体選択的 beta-D-ブシコフラノシル化およびalpha-D-タガトフラノシル化による希少糖誘導体の合成
3. 学会等名 第36回日本薬学会九州支部大会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Yui Makura、Atsushi Ueda、Takashi Matsuzaki、Tetsuo Minamino、Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Stereoselective synthesis of alpha-D-tagatofuranosides using acetonide protection.
3. 学会等名 Rare Sugar Congress 2019 (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 Atsushi Ueda、Yui Makura、Takanori Yamashita、Yuri Nishimura、Masakazu Tanaka、Jun'ichi Uenishi
2. 発表標題 Beta-Selective glycosidation of D-psicofuranose.
3. 学会等名 Rare Sugar Congress 2019 (国際学会)
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 上田 篤志、池田 美鈴、大庭 誠、田中 正一
2. 発表標題 キラル相間移動触媒を用いる -トリフルオロメチル化アミノ酸の不斉合成研究
3. 学会等名 日本薬学会第140年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 真倉 唯、上田 篤志、梅野 智大、加藤 巧馬、平山 和浩、土井 光暢、大庭 誠、田中 正一
2. 発表標題 五員環状ジ置換アミノ酸を利用したE選択的なペプチド側鎖架橋形成法の開発
3. 学会等名 日本薬学会第140年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 佐藤 和樹、梅野 智大、上田 篤志、田中 正一
2. 発表標題 チオウレア部位を導入したヘリカルペプチドによる不斉マイケル付加反応
3. 学会等名 日本薬学会第140年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 梅野 智大、上田 篤志、加藤 巧馬、土井 光暢、田中 正一
2. 発表標題 立体選択的1,3-双極子付加環化反応のためのヘリカルペプチド型ホスフィン配位子の開発
3. 学会等名 日本薬学会第140年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 池田 美鈴、笠江 卓矢、上田 篤志、大庭 誠、土井 光暢、田中 正一
2. 発表標題 光学活性 $\alpha$ -トリフルオロメチル化ジ置換アミノ酸の合成とそのペプチドの2次構造解析
3. 学会等名 第55回化学関連支部合同九州大会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 真倉 唯、上田 篤志、西村 優里、上西 潤一、田中 正一
2. 発表標題 ピリミジン塩基とチオール の 選択的D-ブシコフラノシル化反応
3. 学会等名 第55回化学関連支部合同九州大会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Atsushi Ueda, Mei Higuchi, Suguru Matsumoto, Mitsunobu Doi, Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Conformational analysis of peptides having 1-aminocyclopentanecarboxylic acids with stapled side chain and their applications to organocatalysts
3. 学会等名 The 256th American Chemical Society National Meeting & Exposition (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Atsushi Ueda, Yui Makura, Yuri Nishimura, Masakazu Tanaka, Jun'ichi Uenishi
2. 発表標題 -Selective D-psicofuranosylation of alcohols, pyrimidine bases, and thiols
3. 学会等名 The 256th American Chemical Society National Meeting & Exposition (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 真倉 唯、上田 篤志、西村 優里、田中 正一、上西 潤一
2. 発表標題 D-ブシコフラノースの 選択的 N-及び S-グリコシル化反応の開発
3. 学会等名 第48回複素環化学討論会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 松本 卓、上田 篤志、土井 光暢、田中 正一
2. 発表標題 (-)-メントン由来の , -ジ置換アミノ酸含有ペプチドのX線結晶解析
3. 学会等名 第62回香料・テルペンおよび精油化学に関する討論会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Atsushi Ueda, Tomohiro Umeno, Kazuhiro Hirayama, Mei Higuchi, Mitsunobu Doi, Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Conformational analysis of peptides having , -disubstituted -amino acids and their uses as an organocatalyst
3. 学会等名 ICPAC Langkawi 2018 (招待講演) (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Suguru Matsumoto, Atsushi Ueda, Mitsunobu Doi, Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Synthesis and conformational analysis of peptides having (-)-menthone-derived , -disubstituted -amino acid
3. 学会等名 IKCOC-14 (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Yui Makura, Atsushi Ueda, Jun ' ichi Uenishi, Takashi Matsuzaki, Tetsuo Minamino, Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Stereoselective glycosidation of D-psicofuranose and D-tagatofuranose using ketal protection
3. 学会等名 IKCOC-14 (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 Atsushi Ueda, Misuzu Ikeda, Takuya Kasae, Makoto Oba, Mitsunobu Doi, Masakazu Tanaka
2. 発表標題 Synthesis and analysis of $\alpha$ -trifluoromethylated $\alpha$ -amino acids and their peptides
3. 学会等名 IKCOC-14 (国際学会)
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 池田 美鈴、笠江 卓矢、上田 篤志、大庭 誠、土井 光暢、田中 正一
2. 発表標題 光学活性 $\alpha$ -トリフルオロメチル化置換アミノ酸を含有するペプチドの合成と二次構造解析
3. 学会等名 第35回日本薬学会九州支部大会
4. 発表年 2018年

1. 発表者名 真倉 唯、上田 篤志、上西 潤一、松崎 高志、南野 哲男、田中 正一
2. 発表標題 ケタール保護基を利用したD-プシコフラノースおよびD-タガトフラノースの立体選択的グリコシル化反応
3. 学会等名 日本薬学会第139年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 上田 篤志、樋口 明、梅野 智大、杉山 綾里紗、田中 正一
2. 発表標題 ヘリカルペプチド触媒によるマロン酸エステルの不斉マイケル付加反応とその合成的利用
3. 学会等名 日本薬学会第139年会
4. 発表年 2019年

1. 発表者名 真倉 唯、上田 篤志、梅野 智大、加藤 巧馬、平山 和浩、土井 光暢、大庭 誠、田中 正一
2. 発表標題 ヘリカルペプチドの側鎖炭素架橋形成反応におけるジ置換アミノ酸とE/Z選択性の関係性
3. 学会等名 第10回CSJ化学フェスタ2020
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 佐藤 和樹、梅野 智大、上田 篤志、土井 光暢、加藤 巧馬、田中 正一
2. 発表標題 N末にチオウレア部位を導入したヘリカルペプチド触媒による不斉マイケル付加反応
3. 学会等名 第10回CSJ化学フェスタ2020
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 真倉 唯、上田 篤志、松崎 高志、南野 哲男、田中 正一
2. 発表標題 アセトナイド保護基を利用したD-タガトフラノースの 選択的グリコシル化反応の開発
3. 学会等名 第30回記念万有福岡シンポジウム
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 上田 篤志、佐藤 和樹、梅野 智大、田中 正一
2. 発表標題 ヘリカルペプチドを基盤とした高活性有機分子触媒および不斉配位子としての展開
3. 学会等名 反応と合成の進歩2020特別企画シンポジウム
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 真倉 唯、上田 篤志、皮 金紅、田中 正一、上西 潤一
2. 発表標題 (+)-5-チオスクロースおよび(+)-5-チオイソスクロースの立体選択的合成
3. 学会等名 第39回日本糖質学会年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 上田 篤志、真倉 唯、山下隆則、西村優里、田中 正一、上西 潤一
2. 発表標題 D-ブシコフラノースの 選択的グリコシル化反応の開発
3. 学会等名 第39回日本糖質学会年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 佐藤 和樹、梅野 智大、上田 篤志、土井 光暢、加藤 巧馬、田中 正一
2. 発表標題 N末をチオウレアで修飾したヘリカルペプチド触媒による不斉1,4-付加反応
3. 学会等名 日本薬学会第141年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 真倉 唯、上田 篤志、梅野 智大、加藤 巧馬、平山 和浩、土井 光暢、大庭 誠、田中 正一
2. 発表標題 ペプチド側鎖におけるE選択的i, i+4閉環メタセシス反応
3. 学会等名 日本薬学会第141年会
4. 発表年 2020年

1. 発表者名 上田 篤志、真倉 唯、皮 金紅、田中 正一、上西 潤一
2. 発表標題 D-ブシコフラノースの -選択的グリコシル化を利用した(+)-5-チオスクロースの立体選択的合成
3. 学会等名 日本薬学会第141年会
4. 発表年 2020年

〔図書〕 計0件

〔産業財産権〕

〔その他〕

-

6. 研究組織

氏名 (ローマ字氏名) (研究者番号)	所属研究機関・部局・職 (機関番号)	備考
---------------------------	-----------------------	----

7. 科研費を使用して開催した国際研究集会

〔国際研究集会〕 計0件

8. 本研究に関連して実施した国際共同研究の実施状況

共同研究相手国	相手方研究機関
---------	---------