

科学研究費助成事業（特別推進研究）中間評価

課題番号	20H05618	研究期間	令和2(2020)年度 ～令和6(2024)年度
研究課題名	特殊ペプチド・擬天然物創薬の命題への挑戦	研究代表者 (所属・職) (令和4年3月現在)	菅 裕明 (東京大学・大学院理学系研究科 (理学部)・教授)

【令和4(2022)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-	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	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、研究代表者がこれまで確立してきた非天然アミノ酸単位を含む環状ペプチド(特殊ペプチド)の合成法、評価法を基盤として、中分子創薬の実現を目指し、以下の4項目の検討を通じて、中分子創薬の指針となる経験則を確立する計画である。1) 細胞膜透過性を有する特殊ペプチドの構造膜透過性相関検討による探索基盤の確立、2) 環β-, 環γ-, 不飽和環含有特殊ペプチドライブラリーの翻訳合成と生理活性種探索、3) 翻訳後修飾された擬天然物ライブラリーの創製と生理活性種探索、4) 特殊ペプチド及び擬天然物の細胞膜透過性と小腸吸収性の研究。</p>		
<p>(意見等)</p> <p>これまでに、環β-, 環γ-, 不飽和環アミノ酸を含む特殊ペプチドライブラリーの翻訳合成や生理活性種の探索に加え、擬天然物ライブラリーの創製と生理活性種の探索研究に関して、ほぼ当初の目標が達成されており、細胞膜透過性を有する特殊ペプチドの構造膜透過性相関の検討による探索基盤の確立と特殊ペプチド及び擬天然物の細胞膜透過性と小腸吸収性に関する研究についても成果が上がりつつある。</p> <p>今後は、様々な特殊ペプチドや擬天然物を用いて、細胞膜透過性と小腸吸収性に優れた中分子の構造活性相関データを蓄積し、経口性有機小分子創薬の開発で汎用されているLipinski則に相当する経口性中分子医薬品開発における経験則が得られることを期待する。</p>		