

## 研究課題別事後評価結果

1. 研究課題名： 擬天然物の新機能創出分子技術
2. 研究代表者名及び主たる研究参加者名（研究機関名・職名は研究参加期間終了時点）：  
研究代表者  
菅 裕明（東京大学大学院理学系研究科 教授）  
主たる共同研究者  
なし

### 3. 事後評価結果

○評点：

A+ 非常に優れている
-------------

○総合評価コメント：

本研究課題では、人工擬天然物を試験管内でワンポット合成する技術を確立すると同時に、標的タンパク質に結合する人工擬天然物を迅速に探索するRaPID技術、並びに膜透過性を有する人工擬天然物（特殊環状ペプチドを含む）を探索するLiPID技術を開発し、その技術の完成を目指した。

人工擬天然物のワンポット合成法とRaPIDシステムの確立では、新たに開発したゴールドスポリン類の試験管内ワンポット合成の確立、RaPIDシステムによるアイソフォーム選択的な細胞膜透過性KDM4A阻害剤の合成、及び新規なD-アミノ酸の連続導入法による特殊環状ペプチドライブラリーの構築に成功している。また、膜透過人工擬天然物の超迅速探索法の確立では、特殊ペプチド・擬天然物ライブラリーから膜透過性を指標に含めた活性種のRaPIDセレクションを達成するための技術、LiPIDシステムを開発し、それを応用した活性特殊ペプチド・擬天然物を単離することを目指し研究を遂行した。

研究の独自性、国際的なレベルの高さ並びに科学技術イノベーションの寄与などすべてが一流の研究成果であり、高く評価される。非常に困難と予想される、細胞内薬剤活性を示す人工擬天然物の発見に向けて、一層の進展を期待したい。