

事後評価報告書

機関名：大阪大学大学院

大学等研究者名：工学研究科 教授 井上佳久

課題名：キューカービチュリルを宿主とする超強力人工超分子系の高選択的合成法の開発と
バイオ分野への応用検討

1．目的

大環状分子キューカービチュリルを人工宿主とする系は、アビジン・ビオチン系に代わる新規ツールとして利用し得るものであり、製造コスト、安定性の面での優位性も高いが、キューカービチュリルの誘導体合成の収率ならびに選択性には課題を残す。そこで、本研究では実用化に向けさらに完成度を高めるべく、より選択的かつ高収率にこの超分子を合成する方法および構造を厳密に制御する方法を開発し、バイオ事業への展開を図る。

2．成果の概要

ゲスト化合物の共存化、宿主の合成を行うテンプレート合成法により、キューカービチュリル [7] の合成収率を大幅に向上させることに成功した。

また、新規選択的合成法の採用により、キューカービチュリル [7] への反応性官能基導入量を制限し、ゲスト分子との相互作用の際の立体障害を軽減した構造を実現した。

さらに、この新規選択的合成とテンプレート合成法を組み合わせることにより、官能基導入量を制限したキューカービチュリル [7] の純度向上に至った。

官能基導入量を制限したキューカービチュリル [7] は、修飾し得る部位全てに官能基が導入された従来構造に比べ、ゲスト化合物との相互作用力が約 4 倍大きいことを蛍光検出による比較評価で証明した。構造の簡素化による立体障害の低減が相互作用力の向上に大きく寄与していると考えられる。

3．総合所見

企業研究者の活用により概ね想定通りの成果が得られた。目標設定が実用化を見据えた合成法の確立と機能評価であったが、時間管理も十分意識して短時間間に実用化の目処をつけ、特許出願も果たした点は評価できる。