

# 藤森科学技術振興財団 研究実施概要報告書

(西暦) 2024年 4月17日

公益財団法人藤森科学技術振興財団  
理事長 藤森 明彦 殿

藤森科学技術振興財団の助成金による研究が終了しましたので、下記のとおり報告をいたします。

所属機関 中部大学

職 名 特定教授

氏 名 山本 尚



## 【提出書類】

(1) 研究実施概要報告書(本紙)

添付書類(A4版3枚以内): 研究状況を示す写真等の資料

(2) 収支報告書

添付書類: 助成金を充当した経費の領収書

領収書を添付しない場合: 支払一覧表と支払部門担当者確認署名

(1) テーマ

※スペースが足りない場合は、枠を追加いただいて構いません。

破壊的イノベーションのペプチド合成

(2) 本研究の期間

(西暦) 2023年4月～2024年3月

(3) 本研究の目的

我が国の30年問題を解決するには、いくつかの難問を解く必要がある。最も大切な鍵は、正しいイノベーションを始めることである。残念ながら近年の有機反応開発に関する発明は持続的イノベーションが多い。本当のイノベーションは従来の市場を破壊し、新しい市場を作ることであり、私はこれを破壊的イノベーションと呼んでいる。そして、この破壊的イノベーションに成功すれば、世界の市場を牽引し、新たな景色がみえてくるであろう。

戦後、経済的に大きなダメージを負い先進化学に注力する人員を確保することが難しかった日本では持続的イノベーションを実行することは不可能であった。以降、少しずつ破壊的イノベーションが盛んになり、日本の飛躍的な進歩を手助けした。しかし、残念ながら今日の科学は破壊的イノベーションの実現に、極めて消極的であるように私は感じている。持続的イノベーションだけでは、決して飛躍的な発展がなく、米国では持続的イノベーションだけでは、企業の生命は30年が限度だとも言われており、現状は非常に不安定な状況であると言って良いように思われる。

破壊的イノベーションを実現するためには、研究の目的をしっかりと調査し、その問題に対する飛躍的な改善が可能かを考える必要があり、最低でも数年間を要して作り上げなければならない。しかし、現状のケースでは思いつきで始める研究が多く、これらは科学者の一時の好奇心を満たすのみであり、実用化を考慮すると結果として役に立たないことが多いのではないだろうか。

1964年に固相合成が開発されて以降半世紀の間、ペプチド合成の分野では破壊的イノベーションがほとんど発表されなかった。ペプチドはそれぞれ特徴的な活性官能基を有するアミノ酸の配列分子であり、その配列や導入するアミノ酸の個数に依存して所望の機能を発揮する。これら独特の利点が注目され近年では機能性材料として大きく期待されている。特に医薬品の分野では中分子医薬品として活躍しており、数年の間で承認医薬品数は急増し、世界市場占有率も大きく向上している(*Nat. Rev. Drug Discov.* 2021, 20, 309-325.)。このように非常に重要な創薬材料にもかかわらず、化学合成開発初期の手法から根本的な改良はされてこなかった。我々はこのペプチド合成に着目し、2年ほど調査に費やし、ペプチドをより安価で効率的に合成できる手法の開発に可能性を感じたため研究をスタートした。

本研究の目標は、ペプチドを純度良く、短段階、低価格で、大量に合成できる合成手法を考案し、人類に貢献することである。持続的イノベーションを続け、改良を積み重ねてきた現代のペプチド合成は所望の長鎖ペプチドを速やかに合成することのできる魅力的な手法である。しかし、数年後、数十年後を見据えたときに破壊的イノベーションによるペプチド化学合成を確立することは非常に重要である。本申請研究により遂行できた成果は破壊的イノベーションによるペプチド化学合成の第一歩になったと確信している。この発明を足掛かりとして更なる改良を加えることで、ペプチド医薬品を安価に提供できる未来を築く、さらには我が国の創薬における著しい貿易収支の入超を改善することが可能となるであろう。