

公益財団法人 立松財団 御中

様式 2021A1,A2,B

2025年 9月 22日

所属:三重大学

氏名:増田 裕一



2023 年度 助成

研究 経過 ・ 終了 報告書

※ゴシック文字で記入下さい。

研究テーマ	中分子環状ペプチドの活性立体配座を光制御する技術の開発
研究の結果	<p>光照射により活性化できる化合物を開発すれば、生物活性発現の時間と場所を光照射により制御できることから、医療・生物工学の分野に大きく貢献できる。本研究は、環状ペプチドに光感受性保護基を導入して不活性配座とし、光照射で脱保護して活性配座へ戻す新手法により、中分子環状ペプチドの活性立体配座を光で制御する技術を開発することを目的としている。本研究ではモデル化合物として、低密度リポタンパク質(LDL)の産生を抑制する環状ペプチドPF1171Fを用いた。</p> <p>[成果1] PF1171Fに含まれるピペコリン酸残基の環状構造は、活性立体配座の形成に密接に関係している。そこで、PF1171Fのピペコリン酸残基の側鎖に光感受性保護基である4,5-dimethoxy-2-nitrobenzyl(DMNB)基を導入した類縁体を合成した。現在、光照射により立体配座および生物活性を制御できるかどうかを検証している。</p> <p>[成果2] これまでの研究より、PF1171Fのアミドが形成する分子内水素結合が、本化合物の活性立体配座の形成において重要であることが明らかとなっている。そこで、アミド窒素に光感受性保護基であるo-nitro benzyl(ONB)基を導入したPF1171F類縁体を合成した。ONB基を有する誘導体はPF1171Fとは異なる立体配座を形成しており、生物活性を示さなかった。本誘導体に光照射してONB基を除去すると、活性立体配座に戻って生物活性を示すことを確認した。本法は、環状ペプチドの活性立体配座を光制御する基盤技術となる。</p>
研究発表 (実績)	○林 沙耶, 稲垣 穰, 増田 裕一:環状ペプチドPF1171Fのピペコリン酸側鎖への置換基導入. 日本農芸化学会 中部支部 第202回 例会, ポスター発表 P53(名古屋大学 野依記念学術交流館), 2025年9月20日.

提出期限: 研究期間終了後、すみやかに助成金の「必要経費使途明細書」「領収書」と合わせて提出下さい。
年度をまたぐ場合は毎年3月末日までに、途中経過をご記入の上、報告願います。