

29【P1】Ⅲ-001

複合糖質糖鎖修飾 β -シクロデキストリン類の調製

○大松 瑞恵¹, 生田 亜希子¹, 西 有希¹, 本田 千恵¹, 谷本 敏子¹, 村上 洋², 中野 博文², 北畑 寿美雄³(¹武庫川女大薬,²大阪市工研,³信州大農)

【目的】薬物包接能を有する β -シクロデキストリン (β CD) に、生理活性を有する複合糖質糖鎖の、重要な部分構造であるガラクトシル-*N*-アセチルグルコサミン (Gal-GlcNAc) および GlcNAc 残基を有するオリゴ糖鎖を、結合させた新規複合糖質糖鎖修飾 β CD 類の酵素合成を行う。

【実験と結果】ジャックビーン由来の *N*-アセチルヘキソサミニダーゼの縮合反応を用いて、 β CD と GlcNAc から GlcNAc-(β 1 \rightarrow 6)- β CD (**1**) を合成した。次に、*Bacillus circulans* 由来の β -ガラクトシダーゼの転移反応により、**1** のガラクトシル化物、**2a** および **2b** を得た。アミノカラムを用いた HPLC で単離精製後、MS と NMR により構造を解析した結果、**2a** の構造は Gal が GlcNAc の 4 位に結合した Gal-(β 1 \rightarrow 4)-GlcNAc-(β 1 \rightarrow 6)- β CD、**2b** はさらにその非還元末端の Gal に Gal が結合した Gal-(β 1 \rightarrow 4)-Gal-(β 1 \rightarrow 4)-GlcNAc-(β 1 \rightarrow 6)- β CD と判明した。続いて、Gal-GlcNAc および GlcNAc 残基をマルトトリオース (G3) のスペーサーを介して β CD に結合させるためのオリゴ糖、4 糖および 5 糖を得るため、**1** および **2a** に細菌糖化型 α -アミラーゼを作用させ CD 環を切断した。生成物を HPLC で精製後、MS と NMR 分析により、得られたオリゴ糖鎖は、新規な複合糖質糖鎖の 4 糖 GlcNAc-(β 1 \rightarrow 6)-G3 (GlcNAc-G3) および 5 糖の Gal-(β 1 \rightarrow 4)-GlcNAc-(β 1 \rightarrow 6)-G3 (Gal-GlcNAc-G3) であることを確認した。最後に、*Klebsiella pneumoniae* 由来のプルラナーゼの縮合反応を用いて、 β CD に Gal-GlcNAc-G3 が結合した Gal-GlcNAc-G3- β CD を得た。現在、同様にして β CD に GlcNAc-G3 を結合させた GlcNAc-G3- β CD を合成中である。