

31-1022

核内レセプターの新規リガンドの設計と合成

栗原 正明¹, 〇袴田 航¹, 山内 明日香¹, 佐藤 由紀子¹, 奥田 晴宏¹, 齋藤 望², 本澤 忍², 藤島 利江³, 橘高 敦史² (¹国立衛研, ²帝京大薬, ³徳島文理大香川薬)

【目的】 演者らはこれまでに核内受容体の新規な非天然型のリガンドの設計と合成を行ってきた。今回、ビタミンDレセプター (VDR) のリガンドとして1のような基本骨格を有する新規リガンドの設計と合成を行った。また、RAR の新規リガンドの設計と合成についても報告する。

【方法および結果】 活性型ビタミンD₃が結合したVDRのX線構造を基に、特に疎水相互作用、水素結合を考慮し、リガンドのデザインを行い、合成を行った。Fig. 1に設計し合成したリガンドとVDRの結合モデルを示した。生理活性についても合わせて報告する。

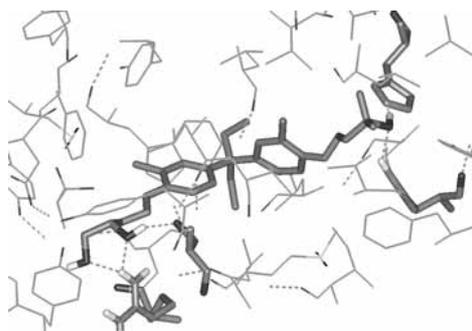
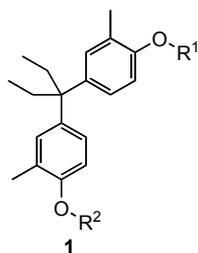


Fig. 1

M. Kurihara, et al, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **14**, 4131-4134 (2004)