

# 26PE-am149

マクロファージ活性化因子GcMAFの糖鎖構造部位をミミックしたGalNAc-Thr dendリマーの分子設計

○柴田 明奈<sup>1</sup>, 中江 崇<sup>1</sup>, 滝口 公康<sup>1</sup>, 宇都 義浩<sup>1</sup>, 中田 栄司<sup>1</sup>, 永沢 秀子<sup>2</sup>, 堀 均<sup>1</sup>(<sup>1</sup>徳島大院ソシオテクノサイエンス研究部, <sup>2</sup>岐阜薬大)

【目的】 GcMAF によるマクロファージ活性化には N-acetylgalactosamine (GalNAc) 残基が重要である。そこで GalNAc 構造に着目し、マクロファージ活性化能を有する低分子化合物として GcMAF の糖鎖構造をミミックした dendリマーの分子設計を試みた。リシン dendリマー (H<sub>2</sub>NK<sub>4</sub>K<sub>2</sub>KβAlaOH, G = 3) 表面に GalNAc およびその結合部位である Thr を 8 個有する化合物の分子設計を行なった。

【方法・結果】 N-acetylgalactosamine 塩酸塩を出発原料とし、4 ステップ、収率 54% でイミデート体を合成した。また、L-Thr から 2 ステップ、収率 36% で Fmoc Thr (OH) OBn を合成した。これらを用いてグリコシル化を行い、α体を収率 57% で合成し、その後 2 ステップで現在 Fmoc Thr (O-GalNAc(OAc)<sub>3</sub>) OH (1) まで合成している。1 と Fmoc<sub>8</sub>K<sub>4</sub>K<sub>2</sub>KβAla PEG Resin を用いてペプチド固相合成法による GalNAc-Thr dendリマーの合成およびマウス腹腔内マクロファージの活性化能を報告する。

