

26G-pm03

脂質、糖鎖、核酸等を一段階で光反応性プローブに誘導する効率的な方法の開発
○谷下 充佳¹, 友廣 岳則¹, 畑中 保丸¹(¹富山大学院)

【目的】結晶化が難しい膜タンパク質などの機能構造を解析する上で、光アフィニティーラベル法は重要な手法の一つである。フェニルジアジリン基はその最も有効な光反応基の一つであるが、誘導体化が困難なためプローブへの誘導は容易ではない。今回、脂質、糖質、核酸等の重要生体分子を一段階で光プローブに誘導する簡便で効率的な方法を開発したので報告する。

【方法・結果】大量合成可能なトリフルオロメチルフェニルジアジリン(**1**)を出発原料とし、菌頭カップリングを利用して様々な生理活性物質に光反応基を組み込むことを試みた。本ルートのキーステップである**1**のヨード化を検討したところ、AgOTf、I₂を用いた反応でジアジリン基に影響を与えずに収率良く反応が進行する事が判明した。更にこのヨード体からエチニル誘導体を合成し、これらの化合物を用いて市販の脂質や糖、核酸のヨードあるいはエチニル誘導体と菌頭カップリングを行い、効率良く種々の光反応性生体分子プローブに導いた。

