

27P-am166

硫酸化チロシンを含むチオエステルセグメントの合成法とそれを用いたセグメント縮合

○関川 由美¹, 北川 幸己¹(¹新潟薬大薬)

【目的】長鎖のペプチドを化学的に合成する方法として、チオエステルセグメント縮合法が有効であることが知られているが、硫酸化チロシンユニットを含むペプチドチオエステルセグメントを合成する方法についてはいまだに確立されていない。そこで本研究では、硫酸化チロシンを含むチオエステルセグメントの合成とそれを用いたセグメント縮合法について検討を行うことにした。

【方法】モデルペプチドとしてN端部に複数の硫酸化チロシン残基を含むケモカインレセプター-CCR5を用いることにした。硫酸基を含むセグメント CCR5[1-8]を Fmoc 法によって固相合成し、C 末端部をチオエステル化した後、保護基の除去、アミノ基の再保護を行った。次いで、得られたチオエステルセグメントを用いて CCR5[9-14]とセグメント縮合を行った。

【結果及び考察】硫酸エステル基を含むペプチドセグメントにおいても、C末端のチオエステル化反応は進行し、目的とする硫酸化チオエステルセグメントを得ることができた。またそれを用いてセグメント縮合を行ったところ、縮合反応は進行し目的物が得られることが確認できた。更に長い硫酸化チオエステルセグメントの合成についても報告を行う。

