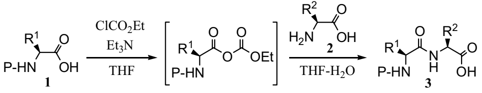
29E02-am08

C端の保護を必要としない簡便ペプチド合成

○野口　拓也[1], 手原　如香[1], 上杉　裕樹[1], 鄭　昇姫[1], 今井　信行[1]([1]千葉科学大薬)

【目的】ペプチド合成においては、一方のα－アミノ酸のN端および他方のα－アミノ酸のC端を保護したうえで、カルボン酸を活性化して縮合する方法が一般的である。しかし、この方法では脱保護を必要とし、比較的高価な保護基を縮合後に廃棄することから、多段階合成においては多くの資源を浪費することになる。我々は、無駄の少ない安価で簡便に操作できるペプチド合成法の開発を目指した。

【方法・結果】N端を Boc 基，Fmoc 基，Cbz 基で保護したα－アミノ酸 **1** を Et_3N の存在下 $ClCO_2Et$ により混合酸無水物とし，無保護のα－アミノ酸を作用させることで、容易に対応するジペプチド **3** を 51～95%の収率で与えた。本法はカルボン酸の活性化後に無保護のα－アミノ酸 **2** 水溶液を加える one-pot 合成で、粗生成物を結晶化するだけで純粋なジペプチド **3** を得られるうえ、ラセミ化を避けることができる非常に有用な方法と言える。



P = Boc, Fmoc, Cbz,

R^1 = $PhCH_2$, R^2 = Me_2CH, Me_3C, $HO_2CCH_2CH_2$, $H_2NCOCH_2CH_2$, $PhCH_2$

Yield = 51-95%

【文献】Noguchi, T.; Tehara, N.; Uesugi, Y.; Jung, S.; Imai, N. *Chem. Lett.*, **2012**, in press.