

27PB-am262

光親和性標識化ネオビブサニン誘導体の合成と標的タンパク質の検出

柳井 翠¹, 小松 加奈¹, ○櫻井 剛志¹, 杉本 実希子¹, 山口 仁美¹, 清水 奈津美¹,

高岸 照久¹, 葛西 祐介¹, 久保 美和¹, 山本 博文¹, 永浜 政博¹, 福山 愛保¹, 今川 洋¹ (徳島文理大薬)

【目的】ネオビブサニン類は、スイカズラ科の植物サンゴジュ (*Viburnum awabuki*) より単離されたジテルペンであり、NGF 刺激による PC12 細胞の突起伸展を促進する。¹⁾ 私たちは、ネオビブサニン B (1) の活性発現機構を明らかにすべく、光親和性標識体の合成と、それをを用いた標的タンパク質の検出実験を行った。

【結果】活性を有する最小構造である三環性アセタール 2 に対し、置換基導入の足場となる側鎖を導入した誘導体 3 を合成した。3 を、Huisgen 環化反応を利用して、ビオチンとベンゾフェノン部を有する鎖状分子と結合することで、光親和性標識体 4 を合成した。ネオビブサニン類は、Trk 受容体下流のシグナル伝達系に作用している可能性が推定されたことから、Trk 受容体を過剰発現している A549 細胞の破碎物に 4 を混合し光照射してサンプルを調整、SDS-PAGE で分析した結果、複数の候補タンパク質の検出に成功した。

