

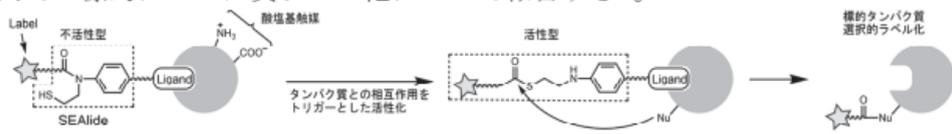
# 26R-am10

## N-Sulfanylethylanilide を用いた細胞内標的タンパク質ラベル化法の開発

○古曳 泰規<sup>1</sup>, 傳田 将也<sup>1</sup>, 藤川 昂樹<sup>1</sup>, 猪熊 翼<sup>1</sup>, 重永 章<sup>1,2</sup>, 小暮 健太郎<sup>1</sup>, 大高 章<sup>1</sup> (徳島大院薬,<sup>2</sup>JST さきがけ)

【目的】タンパク質は、生体内分子との相互作用を経てその機能を発現する。このため、タンパク質の機能解明は単離・精製した状態ではなく、プロテオーム中で行うことが望ましい。近年、プロテオーム中の標的タンパク質選択的ラベル化法として、アフィニティーラベル化法が注目されている。本手法ではラベル化試薬として、タンパク質との共有結合を形成する反応部位を介して標的選択的リガンドとラベルを結合させた試薬が用いられる。これまでに報告されたラベル化試薬は、弱いながらも常に活性化された反応部位を有している。このため、標的タンパク質以外の夾雑物とも反応するおそれがある。そこで演者らは、標的タンパク質との相互作用をトリガーとして活性化されるラベル化試薬が開発できれば、予期せぬ副反応を回避可能と考えた。

【方法・結果】演者の所属する研究室では、リン酸塩などの酸塩基触媒存在下で活性化される *N*-sulfanylethylanilide (SEAlide) を報告している<sup>1</sup>。演者らは、SEAlide をラベル化試薬の反応部位として用いれば、タンパク質表面には多数の酸性・塩基性官能基が存在することからこれらが酸塩基触媒として働く、すなわち標的タンパク質との相互作用をトリガーとして活性化されるラベル化試薬が開発できると考えた。本発表では、SEAlide を基盤としたラベル化試薬の開発とこれを用いた細胞内での標的タンパク質ラベル化について報告する<sup>2</sup>。



1) A. Otaka\*, K. Sato, A. Shigenaga, *Topics Current Chem.* **2015**, *363*, 33-56. 2) M. Denda, T. Morisaki, T. Kohiki, J. Yamamoto, K. Sato, I. Sagawa, T. Inokuma, Y. Sato, A. Yamauchi, A. Shigenaga\*, A. Otaka\*, *Org. Biomol. Chem.* **2016**, *14*, 6244-6251.