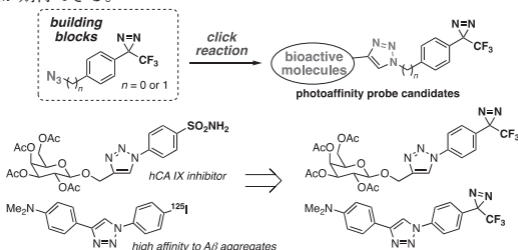


21T-am02

光親和性プローブ候補化合物の簡便合成のためのアジド基置換アリールトリフルオロメチルジアジリジンの開発

○渡辺 賢司¹, 津田 準平¹, 落合 秀紀², 丹羽 節¹, 細谷 孝充^{1,3} (¹理研 BDR, ²理研 CLST, ³東医歯大 生材研)

光親和性標識法は、光反応性官能基を有するプローブ分子を用いて、医薬品などの生物活性化合物の結合タンパク質および結合部位を特定する手法の一つである^{1,2)}。今回我々は、光親和性標識プローブ候補化合物の簡便合成を可能にする手法の開発を目指し、アジド基を有するアリールトリフルオロメチルジアジリジンを2種類合成するとともに、これらが種々のクリック反応に効率的に利用できることを明らかにした³⁾。また、これらのビルディングブロックを用いていくつかの生物活性化合物の光親和性標識プローブ候補化合物を合成した。モデル基質とのクリック反応により得られた生成物は良好な光反応性を示したことから、今後、本手法を利用した光親和性標識プローブの開発が期待できる。



1) *Org. Biomol. Chem.* **2007**, *5*, 2916; 2) *ACS Chem. Biol.* **2018**, *13*, 876; 3) *Heterocycles* in press.