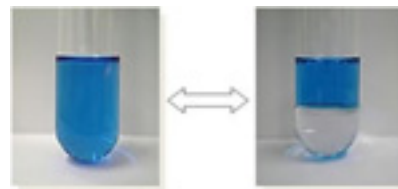


非天然型ペプチド合成のための 新規プロリン類縁体製造方法の開発

企 業 / J I T S U B O 株式会社

研究者 / 千葉 一裕 (東京農工大学 連合農学研究科)



▲ 図：相溶性多相有機溶媒システム

非天然型ペプチド関連物質は、癌、H I V、H C V、痴呆症等の社会要請の極めて高い難治性疾患に関連する、生体機能解明やペプチド系医薬品の開発の中核的役割を果たしている。その一方で、重要構成ブロックである非天然型のアミノ酸と、これらを含むペプチドの体系的合成は、大きなボトルネックとなっていた。これを解決するために、新規プロリン類縁体を迅速かつ網羅的に構築することを開発目標として、有機電解反応と相溶性多相有機溶媒システムとの組合せにより、従来にない革新的な製造方法の開発を行った。

本モデル化により、今まで困難であった反応触媒類と生成物との迅速分離が、僅かな温度変化のみで実現可能になり、高い反応性、収率、変換効率を維持しながら、非天然型プロリン類縁体を選択的に合成、空間分配することに成功した。この結果、非天然型プロリン類縁体を含むペプチドライブラリーを迅速かつ体系的に合成することが可能になった。