

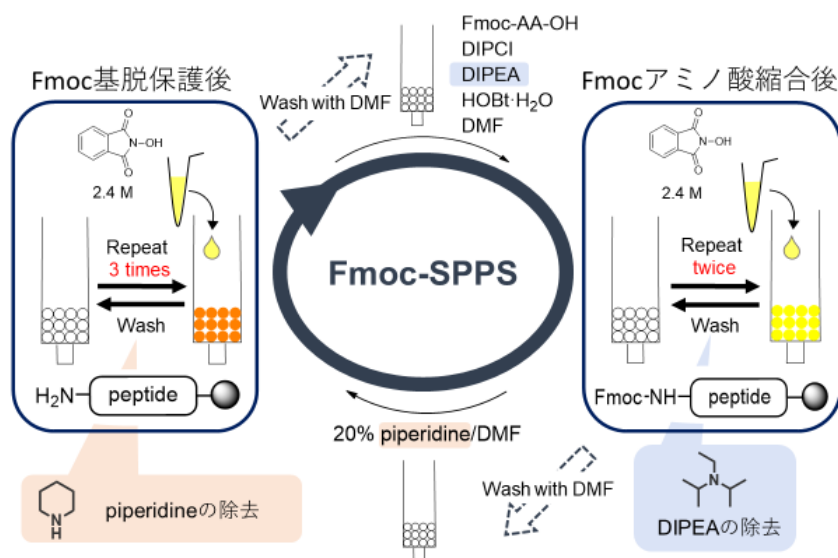


## NHPI を用いた新規アミノ基検出法の固相合成への適用 Application of amino groups detection using NHPI to solid phase peptide synthesis

高松啓吾、鈴木莉緒、今野博行（山形大院理工）

ペプチドを簡便に合成する手段として Fmoc ペプチド固相合成法 (Fmoc-SPPS) がある。この手法では Fmoc アミノ酸の縮合と Fmoc 基の除去を交互に行うことで目的のペプチドを迅速に合成することができる。この時、各反応後にアミノ基の状態を確認することで反応が進行しているのか判断する。アミノ基を検出する手法としてニンヒドリン反応を用いた Kaiser test が主流であるが、樹脂を使い捨て、毒物を使用する。その中、当研究室でアミンと N-hydroxyphthalimide (NHPI) を混合することで反応液が赤く発色する現象を発見した。そこで、本現象をペプチド固相合成におけるアミノ基検出へ適用を試みた。

まず 20 種のタンパク性アミノ酸や N-メチルアミノ酸への適用を試みたところ、全てにおいて室温で瞬時にアミノ基を検出することができた。本発色は DMF で洗浄することで可逆的に消去可能である事が特徴である。またこの手法を用いて目的ペプチドを主生成物として得られることを確認でき、Fmoc-SPPS におけるアミノ基検出に適用可能なことが示された。次に、NHPI の活性部位を調べるために構造活性相関研究を行った。その結果、発色に必須な官能基は芳香環と N-OH であり、芳香環上に電子吸引基のあるものでは、樹脂の発色が赤茶色～茶色へと変化した。最後に、加える試薬の等量と NHPI の色調の関係を色彩計で測定したところ用いる試薬の等量と発色の変化に相関関係があることを見出した。以上の結果から Fmoc-SPPS において迅速な条件検討が可能となった。



### <参考文献>

1) Suzuki, R.; Konno, H. *Org. Lett.* 2020, 22, 3309–3312.

### 発表者紹介

氏名 高松 啓吾（たかまつ けいご）  
所属 山形大学大学院 理工学研究科  
化学バイオ工学専攻  
学年 博士課程前期 1 年  
研究室 生物有機化学分野（今野博行研究室）

