

生体分子の化学修飾を志向した温和な条件におけるボロキサゾリドン形成

(金沢大医薬保¹・ノースカロライナ大²) ○斎藤 洋平¹・吉田 菜々美¹・後藤 (中川) 享子^{1,2}

Boroxazolidone formation under mild conditions toward chemical modification of biomolecules (¹*Graduate School of Pharmaceutical Sciences, Kanazawa University*, ²*Eshelman School of Pharmacy, The University of North Carolina*) ○Yohei Saito,¹ Nanami Yoshida,¹ Kyoko Nakagawa-Goto^{1,2}

Boroxazolidone is a five-membered ring chelate compound in which amino and carboxyl groups on α -amino acid are bound to the boron. The formation of boroxazolidone under appropriate conditions could be applied to the chemical modification to identify target proteins of bioactive molecules. However, known synthetic methods for boroxazolidone using amino acids required vigorous reaction conditions, such as high temperature, which are not applicable to the identification of target proteins. After several optimizations, including the use of varied diarylborinic acids, amino acids, and solvents, we have found a proper method to yield the desired boroxazolidone under mild condition in good yield.

Keywords : *Diarylborinic acid; Amino acid; Chemical modification*

ボロキサゾリドンは α -アミノ酸のアミノ基とカルボキシル基がホウ素原子に結合した5員環状のキレート化合物である。ボロキサゾリドン形成は水中でも可能なことから、生理活性分子の標的タンパク質同定法の開発に応用可能な化学修飾として有用であると考えられた。しかし、これまでに複数報告されている合成方法は80℃以上と高温であり、本条件をそのままタンパク質等の生体高分子存在下の化学修飾に利用することは困難であった。従って、より温和な条件での形成を目指し、ジアリールボリン酸の構造、対となるアミノ酸、及び反応溶媒の検討を行った。その結果、一置換ジアリールボリン酸と α -アミノ酸から、37℃で1時間程度の反応時間で対応するボロキサゾリドンを好収率で与える方法を見出した。

