

## ペプチド合成を指向した疎水性アンカー分子の開発

(神奈川大学<sup>1</sup>) ○澄本 慎平<sup>1</sup>・山田 涼生<sup>1</sup>・佐合 一聖<sup>1</sup>・中村 香月<sup>1</sup>・岡田 正弘<sup>1</sup>  
 Development of hydrophobic anchor molecule for liquid-phase peptide synthesis (<sup>1</sup> *Kanagawa University*) Shimpei Sumimoto<sup>1</sup>, Ryou Yamada<sup>1</sup>, Issei Sagou<sup>1</sup>, Kazuki Nakamura<sup>1</sup>, Masahiro Okada<sup>1</sup>

Liquid-phase peptide synthesis (LPPS) is a third generation method for peptide synthesis that combines the best attributes of classical solution peptide synthesis (CSPS) and solid-phase peptide synthesis (SPPS). In recent decades, many anchor molecules were developed for LPPS method. The anchor based LPPS technology were known as “Molecular Hiving” and “AJIPHASE”. These method are useful for peptide synthesis because the anchor based LPPS strategy allows the use of small excesses of reagents and removal of byproducts by simple precipitation or filtration. However, these anchor molecules are not applicable for acid-labile peptides because the cleavage of peptides from anchor molecules is performed using a few percent of TFA. Therefore, we designed anchor molecule which allow their cleavage under weakly acidic conditions. In this study, we evaluated the efficiency of trityl type anchor molecule for LPPS strategy. As a result, we discovered trifluoromethyl group containing anchor molecule **1** which is cleaved under mild acidic condition with hexafluoroisopropanol (HFIP).

**Keywords** : *liquid-phase peptide synthesis; peptide; anchor molecule*

近年、疎水性アンカー分子を使用した液相ペプチド合成法が報告されている。このペプチド合成法は、合成を液相で行えること、過剰な試薬や副生成物を沈澱精製で除去できることから従来の液相合成法と固相合成法の利点を合わせた第3世代のペプチド合成法と言える。この液相ペプチド合成法には様々な疎水性アンカー分子が用いられており、JITSUBO 社の Molecular Hiving™ や味の素社の AJIPHASE® のように実用化されている。しかしながら、合成したペプチドをアンカー分子から切り出すには少なくとも数%の TFA で処理する必要があるため、酸性条件で不安定なペプチドの合成は困難である。このため、本研究では酸性条件に不安定なペプチド合成に利用できる疎水性アンカー分子の設計を目的とした。その結果、トリフルオロメチル基を有するトリチル型アンカー分子 **1** を用いると、ヘキサフルオロイソプロパノール (HFIP) による穏やかな酸性条件での切り出しが可能であることを見出した。

