

シアリル *N*-グリカンの合成研究：凝集制御によるグリコシル化反応の効率化

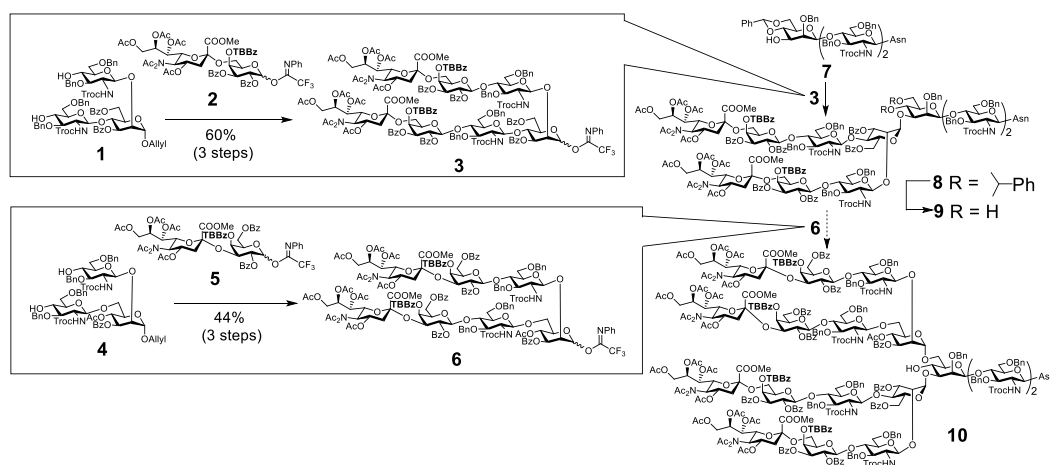
(阪大院理¹) ○矢野 君晟¹・真鍋 良幸¹・深瀬 浩一¹

Synthetic study of sialyl *N*-glycan: Improving efficiency of glycosylation reactions by aggregation control (¹*Graduate School of Science, Osaka University*) ○Kumpei Yano¹, Yoshiyuki Manabe¹, Koichi Fukase¹

Asparagine-linked glycans (*N*-glycans) have diverse and heterogeneous structures. Sialyl *N*-glycans in our body interact with sialic acid-binding immunoglobulin-like lectins (Siglecs) and suppress the immune responses. In this study, we investigated the synthesis of tetraantennary sialyl *N*-glycan possessing sia(2,6)gal and sia(2,3)gal structures. The solubility of protected sialyl fragments in organic solvents is low, resulting in low reactivity in the glycosylations. Therefore, we planned to solve this issue by using *p*-*tert*-butyl (TBBz) group as protecting group, which is reported to prevent intermolecular aggregation. Heptasaccharides **3** and **6** were synthesized by the glycosylation using sia(2,6)gal **2** and sia(2,3)gal **5**, having a TBBz group. The [3+7] glycosylation between **7** and **3** afforded decasaccharide **8**. After cleavage of benzylidene group, the glycosylation with **6** is under investigation.

Keywords : Sialyl *N*-glycan; Glycosylation; Aggregation

生体内では多様な構造のアスパラギン結合糖鎖 (*N*-グリカン) が存在し、その構造に基づいて機能を発現する。その中でも非還元末端にシアル酸を有する *N*-グリカンはシアル酸認識レクチン (シグレック) と相互作用し、免疫抑制作用を示す。本研究では、sia(2,6)gal および sia(2,3)gal を有する 4-分枝シアリル *N*-グリカンの合成を検討した。シアリル糖フラグメントは、基質の溶解性が低く、グリコシル化反応における反応性も低い。そこで、かさ高い *p*-*tert*-butyl (TBBz) 基を保護基として導入し、分子間の凝集を抑え、反応性の向上を図った¹⁾。本合成では TBBz 基を導入した sia(2,6)gal **2** 及び sia(2,3)gal **5** を用い、7 糖 **3** および **6** を合成した。さらに、**3** と **7** を用いたグリコシル化、それに続くベンジリデン基の除去により 10 糖 **9** を得た。現在、この 10 糖に対する **6** を用いたグリコシル化による **10** の合成を検討中である。



- 1) Sachi Asano, Hide-Nori Tanaka, Akihiro Imamura, Hideharu Ishida, Hiromune Ando. *Org. Lett.* **2019**, *21*, 4197–4200.