

ベンゾチアジアゾール型蛍光団を有する蛍光標識ペプチドの合成と応用

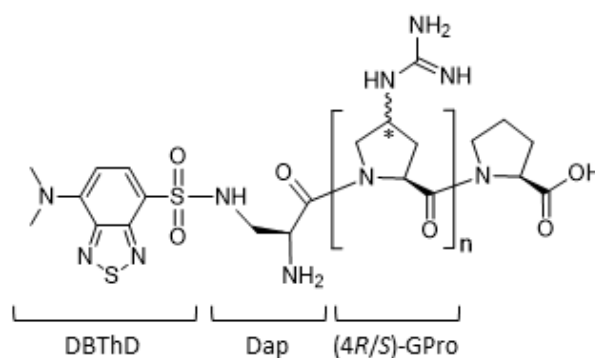
(群馬大院理工) ○山田 圭一

Synthesis and Application of Fluorescent Peptide Containing Benzothiadiazole Fluorophore
(Graduate School of Science and Technology, Gunma University) ○Keiichi Yamada

Fluorescent amino acid derivatives possessing small-size fluorophore are useful building blocks for visualizing intracellular behavior of bioactive peptides with minimizing conformational perturbation and the effect on biological properties. In this study, we synthesized L-2,3-diaminopropionic acid (Dap) derivatives possessing photostable 2,1,3-benzothiadiazole (DBThD¹⁾) fluorophore (Xxx-Dap(DBThD)-OH, Xxx=Boc and Fmoc). We successfully incorporated Dap(DBThD) residue into cell penetrating peptides containing (4*R*/*S*)-guanidino-L-Pro residues. In addition, subcellular localization and bioactivity of these peptides will be reported.

Keywords : *Fluorescent peptides; Benzothiadiazole; Cell penetrating peptides*

分子サイズの小さい可視光励起可能な蛍光団を有するアミノ酸誘導体は、生物活性ペプチドの構造や機能への影響を抑えつつ細胞内挙動を可視化するための有用なビルディングブロックとなりうる。本研究では高い光安定性を有する 2,1,3-ベンゾチアジアゾール型蛍光団 DBThD¹⁾を側鎖に導入した L-2,3-ジアミノプロピオン酸(Dap)誘導体 Xxx-Dap(DBThD)-OH (Xxx = Boc, Fmoc)を合成し、その光物理的性質を調べた。また、Dap(DBThD)を(4*R*/*S*)-guanidino-L-Pro (GPro)を構成単位とする polyproline II helix 型膜透過性ペプチドの N 末端に導入した蛍光性ペプチド H-Dap(DBThD)-(GPro)₇-Pro-OH を合成し、その細胞内局在および生物活性を調べた結果についても併せて報告する。



1) Uchiyama, S.; Kimura, K.; Gota, C.; Okabe, K.; Kawamoto, K.; Inada, N.; Yoshihara, T.; Tobita, S. *Chem.Eur. J.* **2012**, *18*, 9552-9563.