1-アシルリゾ型イノシトールリン脂質の合成と機能解析

（慶大理工）・○伊藤 明文・大久保 花菜・松丸 尊紀・藤本 ゆかり

Synthesis and biofunctions of 1-acyl lyso-phosphatidylinositol (*Faculty of Science and Technology, Keio University*) ○Akifumi Ito, Kana Okubo, Takanori Matsumaru, Yukari Fujimoto

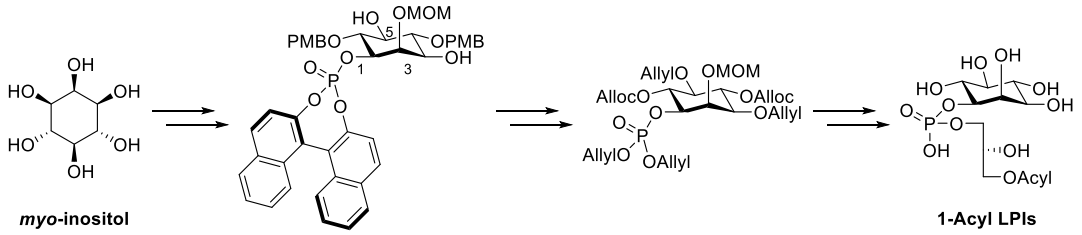
Phosphatidylinositol (PI), a hydrophobic moiety of GPI anchor, have been found as bioactive compounds as well as an anchor of the modified proteins to the cell membrane. Among the PI, lyso-phosphatidylinositols (LPIs) show characteristic immunomodulatory activities. According to our previous work, 1-acyl LPIs, *Eh*PIs from *Entamoeba histolytica*, activate NKT cells via lipid antigen presentation of CD1d.[1, 2]

We thus focused on 1-acyl LPIs with various lipid structures in order to investigate the lipid structure immunomodulatory activity relationships. As for the synthesis of 1-acyl LPIs with various lipid structures, we utilized regioselective phosphorylation,[1] and allyl-protecting group strategy.[2] The biofunctions of the 1-acyl LPIs will be also discussed.

Keywords : Inositol phospholipid; Immunomodulatory activity; Allyl-protecting group

イノシトールリン脂質（PI）は、細胞膜にタンパク質を固定する役割を担う GPI アンカーの部分構造であるが、近年、生物活性物質としての役割も明らかになっている。PI の中でもリゾ型イノシトールリン脂質（LPI）については、原虫 *Entamoeba histolytica* 由来の 1-acyl 型 LPI である *Eh*PI が CD1d 依存的に NKT 細胞を活性化することを当研究室より報告している[1, 2]。

本研究では脂質部分の異なる 1-acyl 型 LPI に着目し、種々の脂質部分を持つ LPI の合成および活性評価を行った。合成に際して、不斉補助基を持つリン酸化試薬を用いた位置選択的なリン酸化[1]、および不飽和結合を含む脂質にも適用可能で温和に除去可能なアリル系保護基を用いた保護基戦略による 1-acyl 型 LPI の構築法を用い[2]、誘導体合成へと展開した。発表では合成した 1-acyl 型 LPI の生物活性評価の結果についても報告する。



1) T. Aiba, S. Suehara, S.-L. Choy, Y. Maekawa, H. Lotter, T. Murai, S. Inuki, K. Fukase, Y. Fujimoto, *Chem. Eur. J.* **2017**, *23*, 8304. 2) S. L. Choy, H. Bernin, T. Aiba, E. Bifeld, S. C. Lender, M. Mühlenpfordt, J. Noll, J. Eick, C. Marggraff, H. Niss, N. G. Roldán, S. Tanaka, M. Kitamura, K. Fukase, J. Clos, E. Tannich, Y. Fujimoto, H. Lotter. *Sci. Rep.* **2017**, *7*, 9472.

© The Chemical Society of Japan