

β -シクロデキストリンとフェニルアダマンタン骨格の改良による強力かつ生体直交的な人工会合系の創製

(富山大院薬) ○小澤魁斗・竹内勇貴・大石雄基・千葉順哉・井上将彦

Development of artificial, bioorthogonal host-guest pairs with high association affinity by derivatization of β -cyclodextrin and phenyladamantane (Graduate School of Pharmaceutical Sciences, Univ. of Toyama) ○Kaito Ozawa・Yuki Takeuchi・Yuki Ohishi・Junya Chiba・Masahiko Inouye

The avidin-biotin system is widely applied in the field of life science. Although avidin strongly associates with biotin, this system has a problem that non-specific binding occurs. Here, we aimed to develop bioorthogonal host-guest pairs by derivatization of β -cyclodextrin and phenyladamantane. β -Cyclodextrin is known to strongly associate with phenyladamantane in water. Based on the molecular design for improved affinity, we synthesized the several candidates, and their association abilities were evaluated with isothermal titration calorimetry. As a result, significantly high affinity was observed between an adamantane derivative having a biphenyl unit and a β -cyclodextrin derivative bearing phenyl groups.

Keywords : Host-Guest Chemistry, Hydrophobic Interaction, Cyclodextrin, Adamantane, Bioorthogonal

アビジン-ビオチン系は生命科学分野において広く応用されている。この会合系は非常に強力である一方、非特異的な相互作用を起こしやすいという問題点を抱えている。今回、水中で強力に会合する β -シクロデキストリンとフェニルアダマンタンに着目し、これらの化学構造を改良し、生体直交的で強力な人工会合系の創製を目指した。会合力の向上を期待した分子設計に基づいて様々な誘導体を合成し、等温滴定型カロリメトリーによりそれらの会合を評価した。その結果、ビフェニル骨格を連結したアダマンタン誘導体とフェニル基を有する β -シクロデキストリン誘導体が特に強く会合することが判明した。

