

多価型複合体の合成研究 (II): カルボシランをコアとする支持体の合成

(埼玉大院理工¹・埼玉先端ラボ²) ○小荒井 俊生¹・松下 隆彦^{1,2}・小山 哲夫¹・幡野 健^{1,2}・松岡 浩司^{1,2}

Synthetic Studies of Multivalent-type Conjugates (II): Synthesis of Carbosilane Architectures as Core Scaffold (¹*Graduate School of Science & Engineering, Saitama University*, ²*Advanced Institute of Innovative Technology (AIIT), Saitama University*) ○Toshiki Koarai,¹ Takahiko Matsushita,^{1,2} Tetsuo Koyama,¹ Ken Hatano,^{1,2} Koji Matsuoka^{1,2}

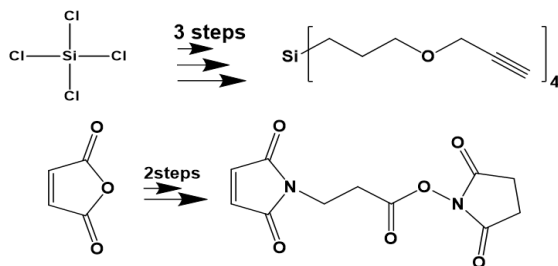
Carbosilane dendrimers have a dendritic structure and a contrasting structure. Since the silicon atom at each branching point on the carbosilane dendrimers is a neutral element, the carbosilane dendrimers are known to be biologically inert. VHH is a kind of antibodies from the camel family and has a compact structure (~15 kDa)¹⁾. In this study, our objective is an establishment of a synthetic method for making multivalent-type VHH in order to enhance its function.

In our previous study, carbosilane dendrimers having tetravalent terminal-alkynes from tetrachlorosilane as a starting material have been prepared. A useful linker between the VHH and the carbosilane dendrimer was synthesized from maleic anhydride and β -alanine, and the details of the results will be reported.

Keywords : Multilateralization; Dendrimer; Silicon

カルボシランデンドリマーは樹状、且つ対照的な構造をしている。また、中心元素であるケイ素は中性元素であるため生物学的に不活性であることが知られている。これまでカルボシランデンドリマーを用いた糖鎖の多価化による機能の向上が確認されてきた。VHHはラクダ科由来の抗体であり、非常にコンパクトな構造を有している(~15kDa)¹⁾。本研究では、VHHの多価化による機能向上を期待して、VHHの多価化合成法の確立を目的とした。

これまで、テトラクロロシランからアルキン化、ハイドロボレーション、最後にプロパルギルブロミドによるエーテル化を行う事により4価の末端アルキンカルボシランデンドリマーを合成した。一方、VHHとカルボシランデンドリマー間のリンカーは、無水マレイン酸と β -アラニンからマレイミドを合成し、*N*-ヒドロキシスクシンイミドにより活性エステルを持つ誘導体へと変換した。



¹⁾ H. Oka, et al., *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **2008**, 18, 4405.