

平成 29 年 2 月 14 日
株式会社伏見製薬所

各位

糖鎖付加新反応開発のご案内

弊社は、これまで S G P など糖鎖関連製品の製造販売を行う中で、その研究開発から新たな反応を開発しましたのでご案内いたします。

1. 新反応について

弊社が開発した新反応は、

- ① 糖鎖をオキサゾリン化糖鎖と呼ばれる中間体に加工、
- ② オキサゾリン化糖鎖を結合させる材料（相手側のタンパク質等）と混合・反応、
- ③ 材料（タンパク質等）に存在するアミノ基に糖鎖が付加するという反応です。

化学構造としては、イミダゾリンまたはイミダゾール構造となり、糖鎖とアミノ基が結合した糖タンパク質等が得られます。この反応は、水中や有機溶媒中で、ほぼ中性条件下で、両者を混ぜるだけで簡単に進み、反応後の精製も容易です。

[Reference] Tetrahedron Letters 57 (2016), 5446-5448
(<http://dx.doi.org/10.1016/j.tetlet.2016.10.074>)

2. 利用可能な分野と用途など

この新技術は、アミノ基が付いた化合物に応用でき、医療、ヘルスケアをはじめとした様々な分野に展開が可能です。まずは、バイオ医薬品、低分子医薬品など付加価値の高い領域からの展開を期待しています。

バイオ医薬品、ペプチド医薬品、低分子医薬品の中には、水に溶解難いために開発中止となった化合物も多数あります。これら難溶の化合物に糖鎖を付けることにより再び医薬品としての開発可能性が高まります。

一方、高分子化合物への糖鎖付加が可能であり、体内に使用する機器類、チューブ類への糖鎖付加により生体適合性の向上が期待できます。

弊社は、新技術を使い様々な領域に使用される材料提供を行いたいと考えています。

【本件に関する問合せ先】

株式会社伏見製薬所 東京営業所 須田 稔

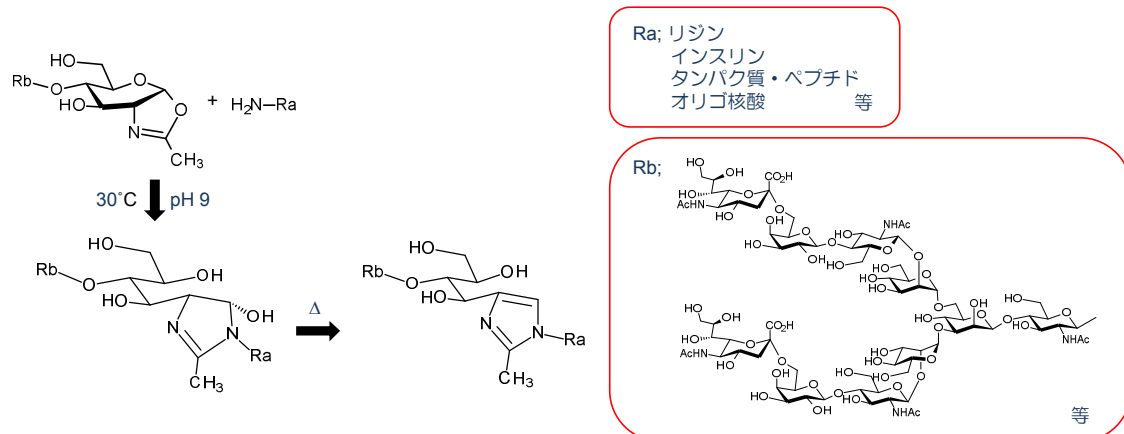
(TEL : 03-6361-9121、E-mail : suda@fushimi.co.jp)

株式会社伏見製薬所 港町工場 開発課 堂崎 雅仁

(TEL : 0877-22-6283、E-mail : dozaki@fushimi.co.jp)

=新反応、用語の解説など=

【今回見出した一般反応式】



【SGP (Sialylglycopeptide、シアリルグリコペプチド)】

非還元末端にシアル酸を持つ糖鎖にペプチドが結合した *N*-結合型糖ペプチド。

【オキサゾリン化糖鎖】

糖鎖の還元末端にある *N*-アセチルグルコサミンを分子内で脱水縮合させ、オキサゾリン環を持つように合成した化合物。

【アミノ基】

アンモニア、第一級アミンまたは第二級アミンから水素を除去してできる 1 価の官能基。

【イミダゾリン】

イミダゾールから誘導される含窒素複素環化合物であり、イミダゾールとは異なり 4 位と 5 位の炭素は単結合である。

【イミダゾール】

五員環上の 1 位と 3 位に窒素を含む複素環式芳香族化合物のアミンの一種。

【タンパク質】

種々のアミノ酸が鎖状に多数結合してできた高分子化合物。

【ペプチド】

2 個以上のアミノ酸がペプチド結合により縮合してできた化合物。

【糖鎖】

糖がグリコシド結合により縮合してできた化合物。