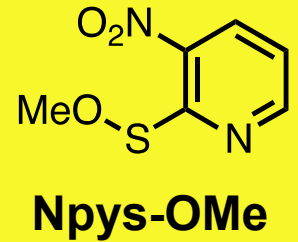


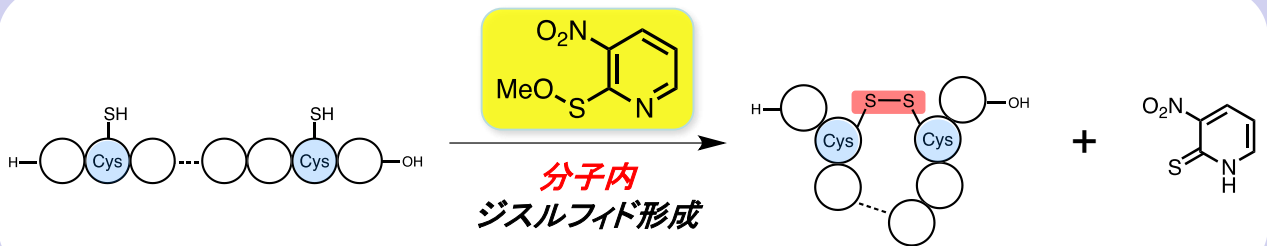
fylladio

「fylladio: フィラディオ」はギリシャ語で「小冊子」を意味します。

東京薬科大学 薬学部 薬品化学教室(林 良雄教授)との共同研究により、3-ニトロ-2-ピリジンスルフェン酸メチルエステル(Npys-OMe)が、ペプチド中のジスルフィド結合形成に有用な化合物であることを見出しました^{1,2}。
(下図: 反応式)



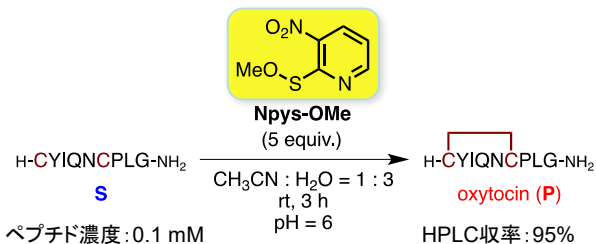
**有機合成、ペプチド合成、創薬研究に効果的な試薬です。
是非、ご検討ください！**



Npys-OMeの利点

- 1) チオール (SH) 基同士の**選択的なジスルフィド結合形成**が可能。
- 2) 従来法(空気酸化)で用いるペプチド濃度よりも**100倍高濃度 (1 mM溶液、弱酸性)**でも反応が可能。
- 3) 酸化されやすいアミノ酸残基を酸化しない**温和な反応**。

反応例1: オキシトシン合成

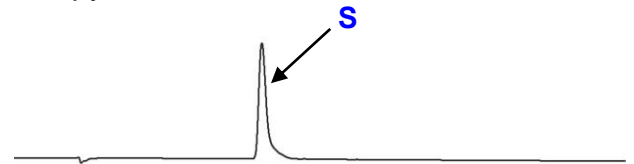


還元型オキシトシン (S) 溶液に、
Npys-OMeを添加、室温にて攪拌

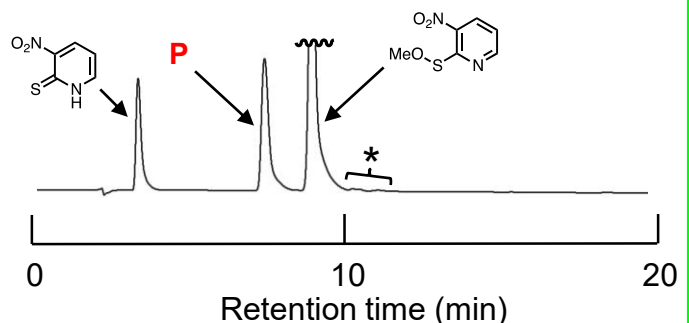


- ✓ 3時間でオキシトシン (P) の効率的な合成が可能 (HPLC収率: 95%)
- ✓ オキシトシンオリゴマーの副生は僅か

A) Npys-OMe添加前



B) 反応3時間

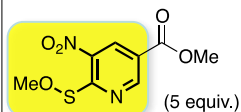


* オキシトシンオリゴマー

反応例2: hANP合成

H-SLRRSSCFGGRMDRIGASGLGCNSFRY-OH

S ペプチド濃度: 1 mM



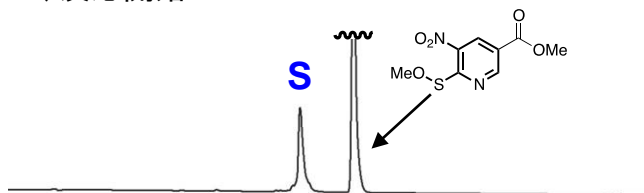
CH₃CN : H₂O = 1 : 3
rt., 24 h, pH = 6
HPLC purification
50%

H-SLRRSSCFGGRMDRIGASGLGCNSFRY-OH

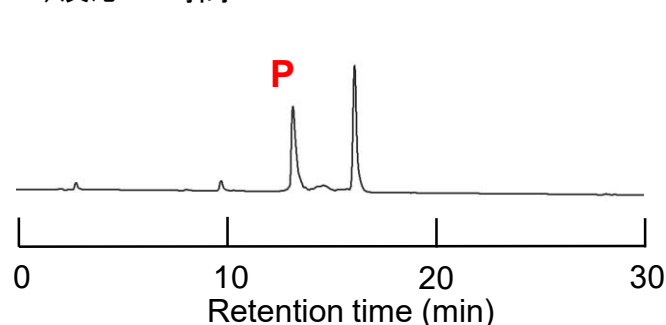
hANP (P)

- ✓ 中分子ペプチド合成への適用も可能
- ✓ メチオニン残基は酸化しない **温和な反応**

A) 反応開始

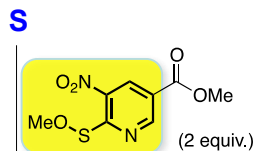


B) 反応24時間



反応例3: α-コトキシニlml合成

H-GCCSDPRCAWRC-NH₂ Acm (保護基)
Acm Acm ペプチド濃度: 1 mM



CH₃CN : H₂O = 1 : 3
rt., 27 h, pH = 6
HPLC purification
61%

H-GCCSDPRCAWRC-NH₂
Acm Acm

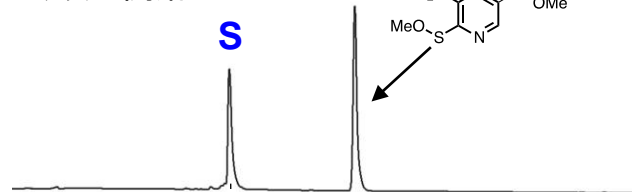
P

他の酸化法

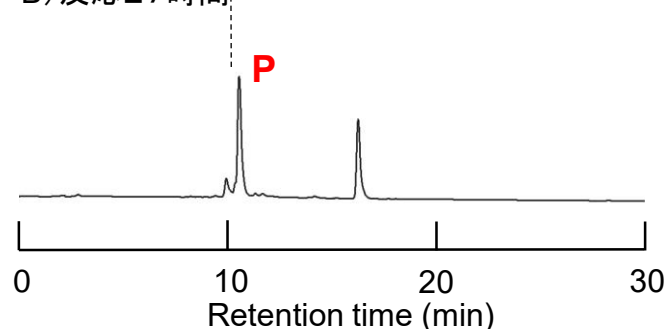
H-GCCSDPRCAWRC-NH₂

α-コトキシニlml

A) 反応開始



B) 反応27時間




- ✓ 無保護SH基の **選択的なジスルフィド結合形成**が可能
- ✓ 他の酸化法との併用により **位置選択的なジスルフィド結合**の構築も可能

参考文献

1) A. Taguchi, Y. Hayashi et. al. *Chem. Eur. J.* **23**, 8262-82 (2017); 2) 林 良雄、田口 晃弘、福元 謙太郎、PCT/JP2017/019086.

カタログNo.	品名	容量	定価(¥)
2580011	"Npys-OMe" (2-(methoxythio)-3-nitropyridine)	100 mg	20,000

 国産化学株式会社

<http://www.kokusan-chem.co.jp>

〒220-0004 神奈川県横浜市西区北幸2-8-29 東武横浜第3ビル 1階

お問い合わせ先

TEL:0120-81-5930 FAX:0120-11-5930

E-mail: cs@kokusan-chem.co.jp

20191016