

Novabiochem® NEWS

最新レジン製品特集



contents

ペプチドチオエステル合成用レジン

側鎖保護ペプチド合成用レジン

高収率化 NovaPEG レジン

化学ライゲーション用途レジン

高膨潤性 PEG-PS レジン

Novabiochem は 30 年以上にわたり、他の追随を許さない品質と革新的な製品で、ペプチド合成とハイスループット有機化学の分野を先導し続けてきました。

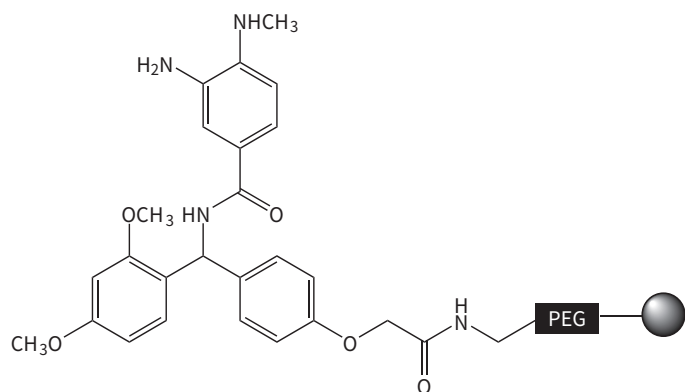
20 種類の主要 Fmoc アミノ酸や Rink アミド樹脂を世界で初めて市場に投入したブランドとして、世界中のペプチド合成研究者から信頼を獲得し、高品質の製品をお届けしております。

Novabiochem News では、最新の技術を反映させた各種製品を特集して紹介しております。

本号ではレジン製品を特集いたします。

ペプチドチオエステル合成用レジン

855157 | MeDbz NovaSyn® TGR resin



ペプチドチオエステル合成用 Dbz レジンの性能が向上しました。分鎖化のリスクを気にせず、塩基触媒作用でのカップリングに使用可能です。

3,4-Diaminobenzoic acid (Dbz) リンカー [1] が、ペプチドチオエステルの有用なツールであることは明白です (Figure 1)[2]。しかしながら、2つのアミノ基の間における立体選択性の低さのために、分鎖ペプチドの生成につながってしまいます。特に、グリシン残基を含む場合は顕著です [3]。近年、Dawson らは第二世代のリンカー、p-アミノ基が N-メチル化されたものを報告しています [4]。この工夫により二重アシル化を避け (Figure 2)、塩基性環境下においても、Fmoc SPPS でのペプチドチオエステル合成の強力な選択肢となります。Novabiochem では、メチル Dbz リンカーの付いた NovaSyn TGR レジンを提供しております。この製品は他の Dbz レジンと同様の条件で使用可能です。加えて、最初のアミノ酸導入反応時に特別な条件が不要というメリットがあります。ペプチド鎖の伸長は p-アミノ基上で進み、p-ニトロフェニルクロロフォルマートと反応しイミダゾリジノン (MeNbz) を生成後、TFA にて切り出されます。ペプチド-MeNbz は化学ライゲーション反応に使われ、in situ で望ましいペプチドチオエステルを生成します (Figure 1)。

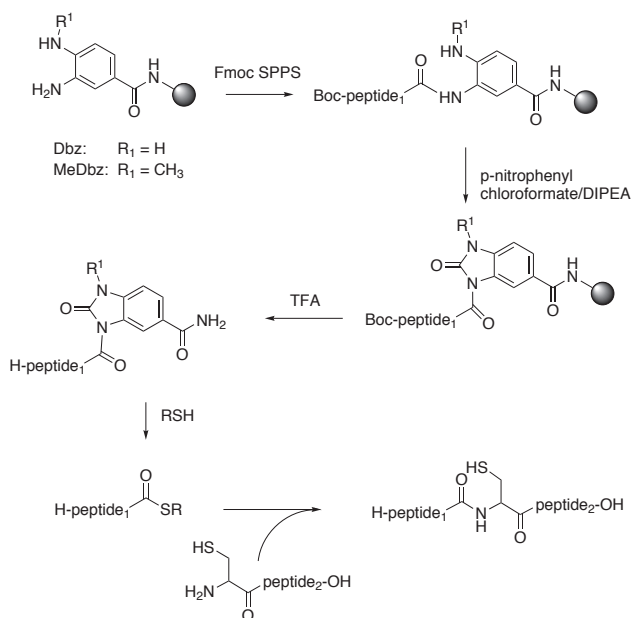


Figure 1 : (Me)Dbz レジンをを用いたペプチドチオエステルの合成

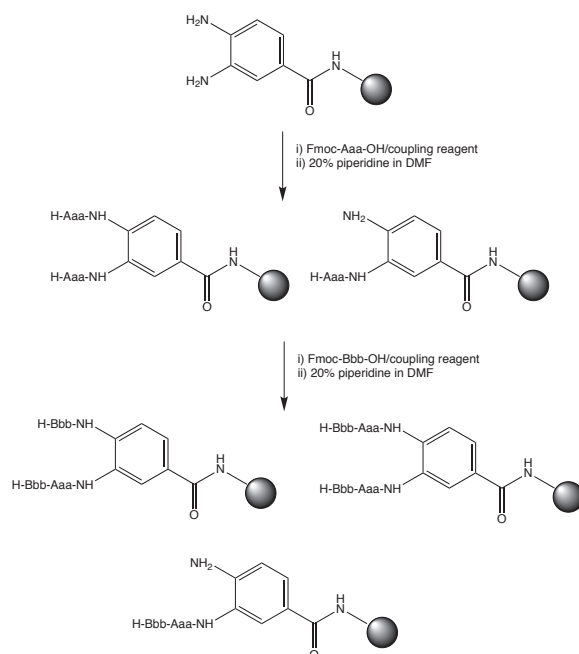
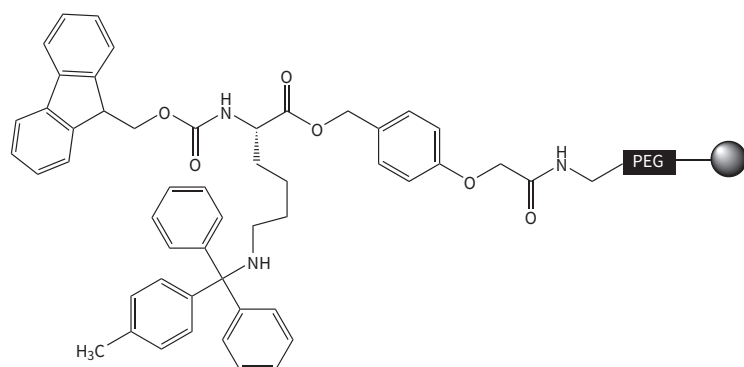


Figure 2 : Dbz リンカミドレジンにおける分鎖

製品名	容量	カタログ番号
MeDbz NovaSyn® TGR resin NEW	1g 5g	855157
Dawson Dbz Rink AM resin (100 - 200 mesh)	1g 5g	855131
Dawson Dbz NovaSyn TGR resin	1g 5g	852142

側鎖保護ペプチド合成用レジン

856221 | Fmoc-Lys(Mtt)-Wang resin LL (100-200 mesh)



Mtt 基は 1% TFA DCM 溶液で、一般的な保護基に影響を与えることなく脱保護が可能です。また、レジン上で、C-末端リシンの側鎖ε-アミノ基の修飾が可能です。

※Mtt基:4-Methyltrytyl基

Novabiochem の Fmoc-Lys(Mtt)-Wang resin LL は、ビオチンや蛍光色素、他の C-末端でラベル化されたペプチドの合成に最適なツールです。Mtt 基は、t-ブチル系の標準的な保護に影響を与えることなく、1% TFA DCM 溶液を用いて、固相上で脱保護が可能です。マスクされていないアミノ基は、ビオチン、蛍光色素およびカルボン酸官能性を有する任意の部分をアシル化することが可能です。TFA による切り出しにより、C-末端リシンのε-アミノ基に標識されたペプチドが生成されます。

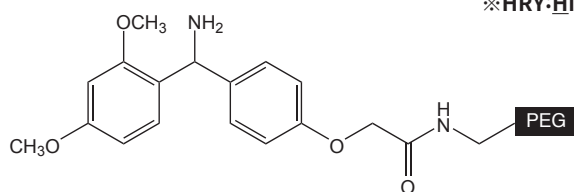
このレジンは、ローディング値の低い Wang レジンから製造され、既存のローディング値が高い Fmoc-Lys(Mtt)-Wang レジンシリーズを補完します。ローディング値が低いレジンは、より長鎖で凝集し易いペプチド合成にさらに適しています。

製品名	容量	カタログ番号
Fmoc-Lys(Mtt)-Wang resin LL NEW	1g 5g	856221
Fmoc-Asp(Wang resin)-OAll (100-200mesh)	1g 5g	856023
Fmoc-Glu(Wang resin)-OAll	1g 5g	856024
Fmoc-Glu(Wang resin)-ODmab (100-200mesh)	1g 5g	856022
Fmoc-Glu(OtBu)-Wang resin (100-200 mesh)	1g 5g	856008
Fmoc-Lys(ivDde)-Wang resin (100-200mesh)	1g 5g	856186
Fmoc-Lys(Alloc)-OH	5g 25g	852124
Fmoc-Lys(Mtt)-Wang resin (100-200mesh)	1g 5g	856021
Fmoc-Asp(Wang resin LL)-OAll (100-200mesh)	1g 5g	856121
Fmoc-Asp(Wang resin LL)-ODmab (100-200mesh)	1g 5g	856123
Fmoc-Glu(OtBu)-Wang resin LL (100-200mesh)	1g 5g	856109
Fmoc-Glu(Wang resin LL)-OAll (100-200mesh)	1g 5g	856122
Fmoc-Glu(Wang resin LL)-ODmab (100-200mesh)	1g 5g	856124

高収率化 NovaPEG レジン

855158 | NovaPEG Rink Amide resin HRY

※HRY:High Recovery



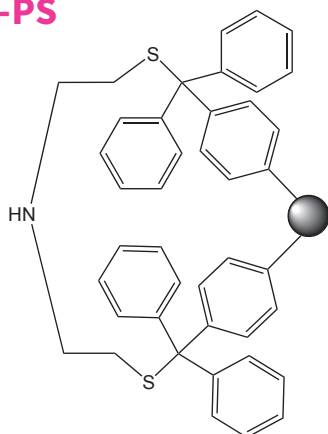
難しいペプチドの合成収率を高める工夫が施された、NovaPEG Rink Amide の登場です。

NovaPEG レジンは、一般的に合成が難しい長鎖ペプチドなどには最適のレジンです。その一方で、収率の低さが弱点でした。Novabiochem の新製品、NovaPEG Rink Amide resin HRY は、NovaPEG レジンをベースとしてレジン設計に改良が施されています。レジンはリンクアミドリinkerで固定化されており、凝集し易く合成が難しいペプチドアミドの合成に適しています。

製品名	容量	カタログ番号
NovaPEG Rink Amide resin HRY NEW	1g 5g	855158
NovaPEG Rink Amide resin	1g 5g 25g	855047
NovaPEG Rink Amide resin LL	1g 5g	855125

化学ライゲーション用途レジン

855152 | SEA-PS



ネイティブ化学ライゲーションに利用可能なチオエステルを生成します。

SEA-PS レジンは Fmoc SPPS によるネイティブ化学ライゲーション (NCL) のための、新しいツールです [5-7]。このレジンでは TFA での切り出し時、bis(2-sulfanylethyl)amide (SEA) を C-末端に持つペプチドを生成します。このペプチドは中性の pH 域において、チオエステル型とアミド型の混合物として存在します。チオール基を持つ化合物が存在する場合、SEA 基が脱離しペプチドチオエステルを生成し、単離または in situ NCL に使用できます (Figure 3)。

C-末端残基を持つレジンの導入は、通常は HATU で活性化した Fmoc アミノ酸でおこなわれます。ペプチド合成後、ペプチド-SEA は標準的な TFA 混合物にて樹脂から切り出されます。ペプチドを安定化させ、酸性緩衝液中での HPLC 分析および精製を容易にするために、SEA ペプチドは空気またはヨウ素酸化によってジスルフィド型に変換される必要があります。

TCEP のような還元剤の存在下で、ペプチド-SEA ジスルフィドは即座に NCL を起こすか、またはチオエステルに変換することができます。還元剤が存在しない場合に、ペプチド-SEA ジスルフィドが、ワンポットで 3 箇所のライゲーションを引き起こす反応も報告されています [8]。

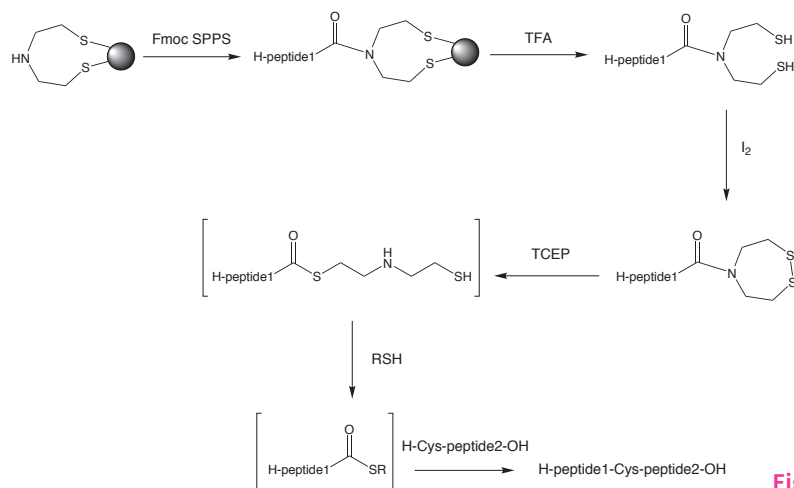


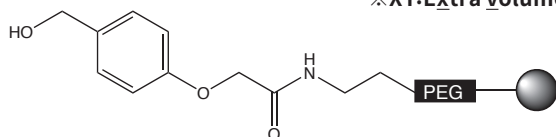
Figure 3: SEA strategy [5-8]

製品名	容量	カタログ番号
SEA-PS NEW	1g 5g	855152

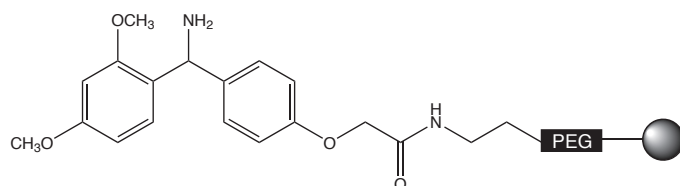
高膨潤性 PEG-PS レジン

855156 | NovaSyn® TGXV A resin

※XY:Extra volume



855155 | NovaSyn TGXV R resin



NovaSyn TGXV A・NovaSyn TGXV R レジンは、それぞれ NovaSyn TGA・NovaSyn TGR をベースとし、Chemmatrix レジンに匹敵する高膨潤性を達成したレジンです。長鎖で難しいペプチド合成時の最適な選択肢となるでしょう。

製品名	容量	カタログ番号
NovaSyn TGXV A resin NEW	1g 5g	855156
NovaSyn TGXV R resin NEW	1g 5g	855155
NovaSyn TGR A resin	1g 5g	855127
NovaSyn TGR R resin	1g 5g	855128
NovaSyn TG A resin	1g 5g 25g	855005
NovaSyn TG R resin	1g 5g 25g	855009

文献

- [1] J. B. Blanco-Canosa & P. E. Dawson (2008) *Angew. Chem. Int. Ed.*, **47**, 6851.
- [2] Z. Harpaz, et al. (2010) *ChemBioChem*, **11**, 1232; B. L. Pentelute, et al. (2010) *ACS Chem. Biol.*, **5**, 359; c) T. K. Tiefenbrunn, et al. (2010) *Pept. Sci.*, **94**, 405.
- [3] P. D. White & R. Behrendt (2010) *J. Pept. Sci.*, **16 Suppl. 1**, 71 – 72.; S. K. Mahto, et al. (2011) *ChemBioChem*, **12**, 2488.
- [4] J. B. Blanco-Canosa, et al. (2015) *J. Am. Chem. Soc.*, **137**, 7197.
- [5] N. Ollivier, et al. (2010) *Org. Lett.*, **12**, 5238.
- [6] J. Dheur, et al. (2011) *J. Org. Chem.*, **76**, 3194.
- [7] J. Dheur, et al. (2011) *Org. Lett.*, **13**, 1560.
- [8] N. Ollivier, et al. (2012) *Angew. Chem. Int. Ed.*, **51**, 209.

Novabiochem のカタログ ダウンロード、および最新情報はこちら
www.sigma-aldrich.com/novabiochem-jp



メルク・シグマの試薬はバルク対応が可能です！

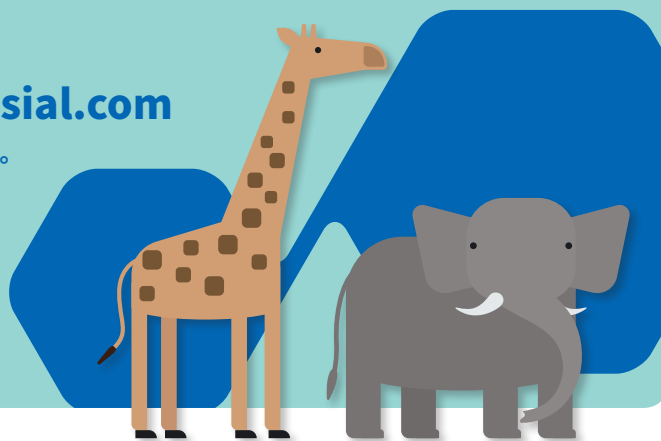
- 原料、試験研究用どちらにも対応いたします。
- カタログ品の最大容量の 20 倍より対応いたします。

下記アドレスへお気軽にお問い合わせください。

バルク専用メールアドレス : mj_bulk@sial.com

お問い合わせの際は下記を記載いただけますとスムーズです。

- 用途（原料用、研究用）
- カタログ番号
- 数量
- ご希望の納期
- ご予算



本紙記載の製品は試験・研究用です。ヒト、動物への治療、もしくは診断目的として使用しないようご注意ください。本紙記載の製品構成は諸般の事情により予告なく変更となる場合がありますのでご了承ください。記載価格に消費税は含まれておりません。本文中のすべてのブランド名または製品名は特記なき場合、Merck KGaA の登録商標もしくは商標です。本紙記載の内容は 2018 年 3 月時点の情報です。©2018 Merck KGaA, Darmstadt, Germany. All rights reserved.

メルク株式会社

ライフサイエンス リサーチ事業部

〒153-8927 東京都目黒区下目黒 1-8-1 アルコタワー 5F

製品の最新情報はこちら www.merckmillipore.jp/bio

E-mail: jpts@merckgroup.com

Tel: 03-4531-1140 Fax: 03-5434-4859

CHM004-1803-pdf-S