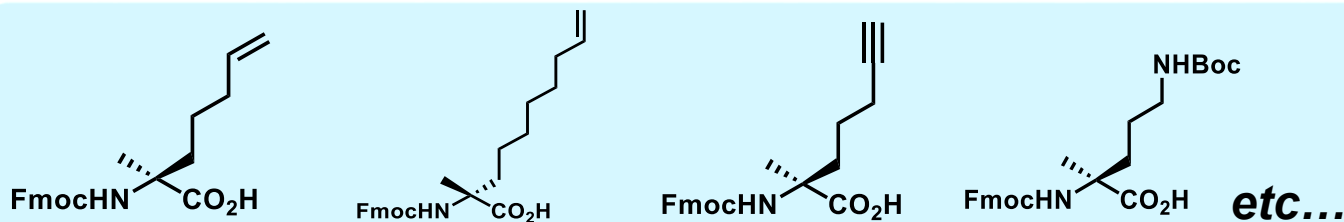


Stapled peptide 合成用 非天然型アミノ酸のご紹介

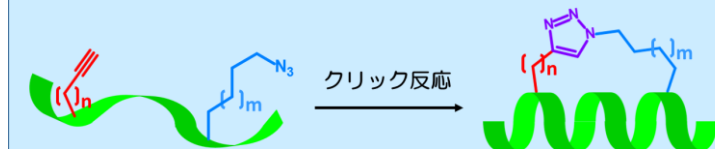
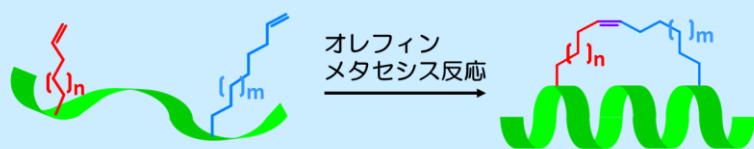


KISHIDA



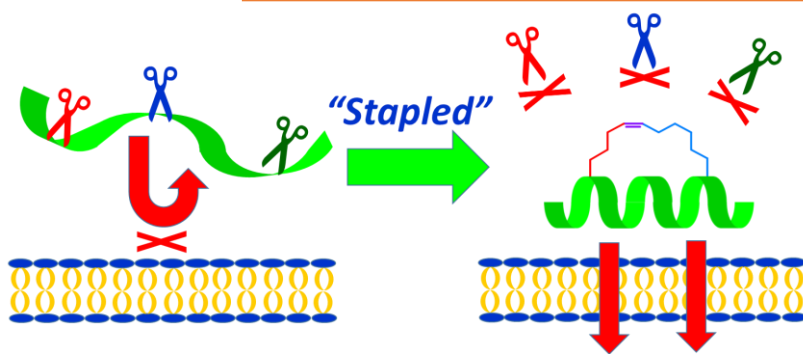
◆Stapled peptideとは??

結合可能な官能基を有する2種の非天然型アミノ酸を直鎖ペプチドに組み込んだ後に、架橋構造を形成させ、 α -Helixなどの主鎖3次元構造を固定化させる技術で、タンパク-タンパク相互作用 (PPI) に関わる薬剤への応用が盛んになされています^{a)}。下図の反応等により様々なstapled peptide構築が可能です^{b)}。



◆Stapled peptide に期待される機能

薬理活性や体内動態の改善が期待



プロテアーゼ耐性↑

活性コンフォメーション
の固定化(活性↑)

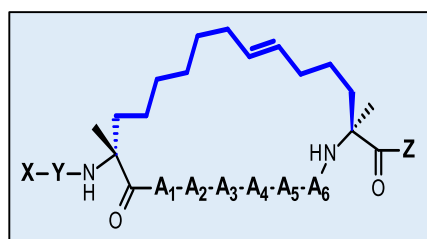
膜透過性↑

◆Stapled peptide 応用例：詳細はこちらでご確認！⇒

キシダ 非天然型アミノ酸

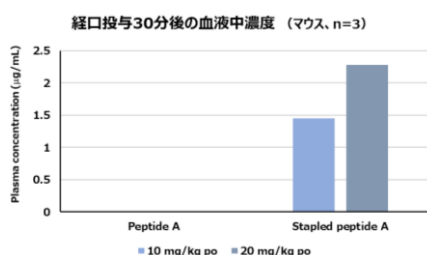
検索

◎報告例 1



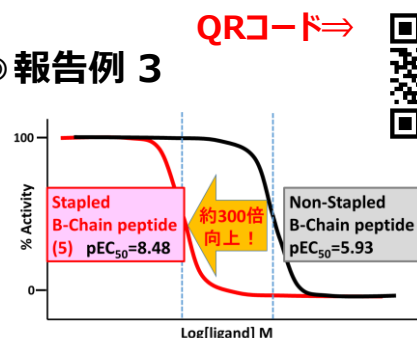
治験薬の例

◎報告例 2



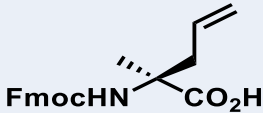
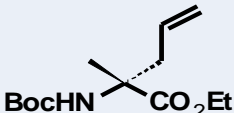
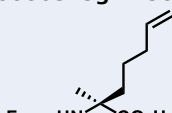
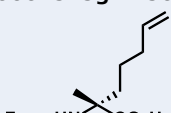

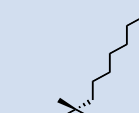
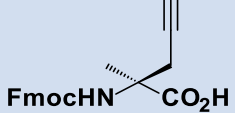
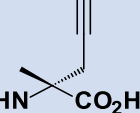
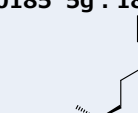
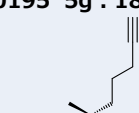
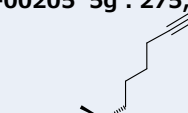
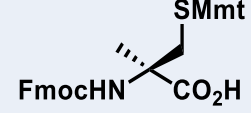
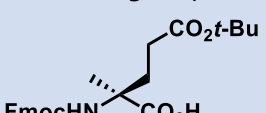
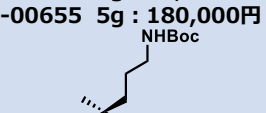
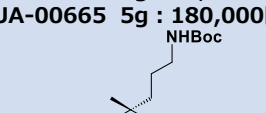
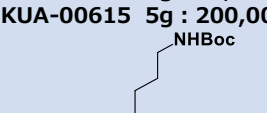
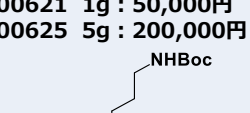
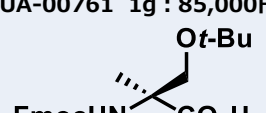
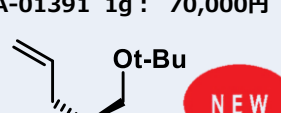
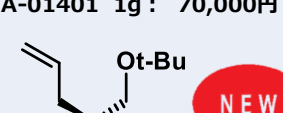
抗HIV活性を有する
ペプチド化合物創出
(薬理活性、体内動態改善)

◎報告例 3



Relaxin-3
(insulin-relaxin family)
agonist 創出 (薬理活性向上)

◆Stapled peptide 合成用非天然型アミノ酸 主な製品ラインアップ

<p>KUA-00031 1g : 55,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂CH=CH₂)-CO₂H</p> <p>(S)-N-Fmoc-α-Allylalanine CAS RN® 288617-71-0</p>	<p>KUA-00051 1g : 50,000円</p>  <p>BocHN-CH(CH₂CH=CH₂)-CO₂Et</p> <p>(R)-N-Boc-α-Allylalanine ethyl ester CAS RN® 1263046-12-3</p>	<p>KUA-00061 1g : 45,000円 KUA-00065 5g : 150,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂CH₂CH=CH₂)-CO₂H</p> <p>(S)-N-Fmoc-α-(4-Pentenyl)alanine CAS RN® 288617-73-2</p>	<p>KUA-00071 1g : 45,000円 KUA-00075 5g : 150,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂CH₂CH=CH₂)-CO₂H</p> <p>(R)-N-Fmoc-α-(4-Pentenyl)alanine CAS RN® 288617-77-6</p>
<p>KUA-00101 1g : 55,000円 KUA-00105 5g : 160,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂(CH₂)₆CH=CH₂)-CO₂H</p> <p>(S)-N-Fmoc-α-(7-Octenyl)alanine CAS RN® 288617-75-4</p>	<p>KUA-00111 1g : 55,000円 KUA-00115 5g : 160,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂(CH₂)₆CH=CH₂)-CO₂H</p> <p>(R)-N-Fmoc-α-(7-Octenyl)alanine CAS RN® 945212-26-0</p>	<p>KUA-00161 1g : 45,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂C≡CH)-CO₂H</p> <p>(S)-N-Fmoc-α-Propargylalanine CAS RN® 1198791-58-0</p>	<p>KUA-00171 1g : 45,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂C≡CH)-CO₂H</p> <p>(R)-N-Fmoc-α-Propargylalanine CAS RN® 1198791-65-9</p>
<p>KUA-00181 1g : 60,000円 KUA-00185 5g : 180,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂(CH₂)₃C≡CH)-CO₂H</p> <p>(S)-N-Fmoc-α-(4-Pentynyl)alanine CAS RN® 1050501-65-9</p>	<p>KUA-00191 1g : 60,000円 KUA-00195 5g : 180,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂(CH₂)₃C≡CH)-CO₂H</p> <p>(R)-N-Fmoc-α-(4-Pentynyl)alanine CAS RN® 1198791-56-8</p>	<p>KUA-00201 1g : 85,000円 KUA-00205 5g : 275,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₂(CH₂)₄C≡CH)-CO₂H</p> <p>(R)-N-Fmoc-α-(5-Hexynyl)alanine CAS RN® 1198791-69-3</p>	<p>KUA-00501 1g : 60,000円</p>  <p>SMmt FmocHN-CH(CH₃)-CO₂H</p> <p>(R)-L-N-Fmoc-S-Mmt-α-Methylcysteine CAS RN® 1198791-74-0</p>
<p>KUA-00531 1g : 90,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₃)-CO₂t-Bu</p> <p>(S)-N-Fmoc-α-Methylglutamic acid-5-tert-butyl ester CAS RN® 1072845-48-7</p>	<p>KUA-00651 1g : 45,000円 KUA-00655 5g : 180,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₃)-CO₂H NHBoc</p> <p>(S)-N-α-Fmoc-N-δ-Boc-α-Methylornithine CAS RN® 1315449-95-6</p>	<p>KUA-00661 1g : 45,000円 KUA-00665 5g : 180,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₃)-CO₂H NHBoc</p> <p>(R)-N-α-Fmoc-N-δ-Boc-α-Methylornithine CAS RN® 171860-40-5</p>	<p>KUA-00611 1g : 50,000円 KUA-00615 5g : 200,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₃)-CO₂H NHBoc</p> <p>(S)-N-α-Fmoc-N-ω-Boc-α-Methyllysine CAS RN® 1202003-49-3</p>
<p>KUA-00621 1g : 50,000円 KUA-00625 5g : 200,000円</p>  <p>FmocHN-CH(CH₃)-CO₂H NHBoc</p> <p>(R)-N-α-Fmoc-N-ω-Boc-α-Methyllysine CAS RN® 1315449-94-5</p>	<p>KUA-00761 1g : 85,000円</p>  <p>Of-Bu FmocHN-CH(CH₃)-CO₂H</p> <p>(S)-N-Fmoc-O-tert-Butyl-α-Methylserine CAS RN® 914399-98-7</p>	<p>KUA-01391 1g : 70,000円</p>  <p>Ot-Bu H₂N-CH(CH₂CH=CH₂)-CO₂H</p> <p>(S)-O-tert-Butyl-α-Allylserine CAS RN® -</p>	<p>KUA-01401 1g : 70,000円</p>  <p>Ot-Bu H₂N-CH(CH₂CH=CH₂)-CO₂H</p> <p>(R)-O-tert-Butyl-α-Allylserine CAS RN® -</p>

Boc : tert-Butoxycarbonyl, Fmoc : 9-Fluorenylmethoxycarbonyl, Mmt : 4-Methoxytrityl,

記載されております試薬は、試験研究以外に使用しないでください。

上記記載製品以外にも、多数の非天然型アミノ酸製品を取り揃えております。
カタログにない非天然型アミノ酸につきましてもご相談を承ります。

カスタム製造品として費用をお見積りさせていただきます。

もちろん秘密厳守で、ご相談、お見積りは無料です。

◆ 参考

a) M. Moiola et. Al., *Molecules* **2019**, 24, 3654 b) Y. Tian et. al., *ChemBioChem* **2017**, 18, 2087



KISHIDA
キシダ化学株式会社

URL : <http://www.kishida.co.jp>

E-mail : shiyaku@kishida.co.jp

本社(大阪) TEL (06)6946-8134 FAX (06)6946-8135

東京 TEL (03)5625-5591 FAX (03)5625-5592

つくば TEL (029)833-6011 FAX (029)833-6012

沼津 TEL (055)926-6711 FAX (055)926-6712

福岡 TEL (092)622-0422 FAX (092)621-8954

山口 TEL (0834)22-3177 FAX (0834)22-2625