

## 縮合剤不要の革新的アミド化反応

ライセンス契約を受けていただき 本発明の実用化を目指していただける企業様を求めます。

アミド化反応に縮合剤を用いない新手法を開発し、一般的なペプチド合成方法に伴う多くの問題を一挙に解決しました。

### ◆背景

複数のアミノ酸がアミド結合したペプチドは、中分子医薬品としても利用されています。しかしその合成過程におけるアミド化反応では縮合剤を必要とし、大量の廃棄物が出てしまいます。さらにはエピメリ化が生じる、過剰量の試薬を使う必要がある、精製過程が煩雑など合成コストが高く、ペプチド医薬品の薬価高騰の原因にもなっています。

### ◆発明概要と利点

発明者らは、縮合剤を用いず安価な試薬を用いて、エピメリ化なしでアミド化反応を引き起こす方法を確立しました。本発明技術を用いれば縮合剤を使うことなく低コストで安全性も高く、光学純度良いペプチド合成が行えます。

#### ➢ ペプチド合成における生産コストが低い

アミド化反応に用いる試薬は安価です。過剰量の試薬を投入する必要もありません。共生成物にも商業価値があり、廃棄物も少ないため、低コストでペプチド合成が可能であり、ペプチド合成に伴う諸問題を解決できます（表1）。

#### ➢ エピメリ化が起こりにくい

アミド化反応後のジアステレオマー過剰率は99%(de)以上で、反応物が高効率で得られます（図1）。

#### ➢ 生成物の精製が容易

分液抽出で目的物を精製でき、シリカゲルクロマトグラフィーは不要です。

#### ➢ 人に優しい

反応に有害かつPRTRに該当する溶媒を使用しません。

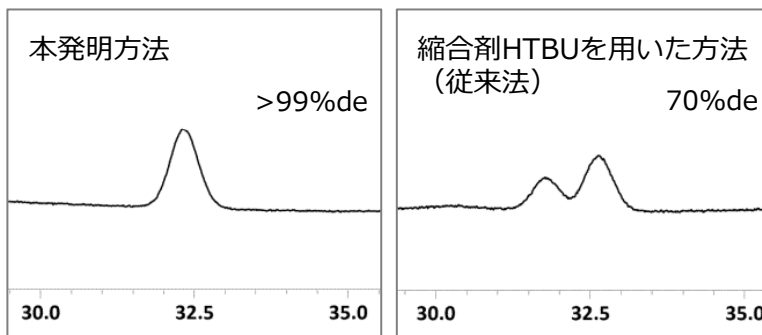


図1. 合成アミドの比較

本発明方法と従来法でアミドを合成し、HPLCによってジアステレオマー過剰率 (de) を解析しました。

	コスト	エピメリ化	精製	安全性
本発明方法	低い	起こらない	手軽	向上
従来法	高い	頻発する	手間	難あり

表1. 従来法との比較

本発明方法を用いたアミド化反応を採用することによって、ペプチド合成に関わる多くの問題を解決することができます。

### ◆開発段階

- アミノ酸同士のアミド化反応がエピメリ化なしで可能であることを確認

### ◆適応分野

- ペプチド合成
- ペプチド中分子創薬

### ◆希望の連携形態

- 実施許諾
- オプション (非独占/独占)

※本発明は京都大学から特許出願中です。

### ◆お問い合わせ先

京都大学産学連携担当  
株式会社TLO京都

〒606-8501  
京都市左京区吉田本町  
京都大学 産官学連携本部内  
(075)753-9150  
event@tlo-kyoto.co.jp

