

ベンゾオキサボロールで化学修飾されたキモトリプシンの調製とその性質

(金工大応化) ○土谷 涼翔・吉田 大和・小野 慎

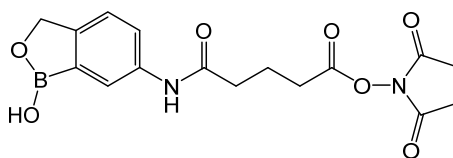
Preparation and properties of chymotrypsin chemically modified with benzoxaborole
(Department of Applied Chemistry, Kanazawa Institute of Technology) ○Ryoga Tsuchiya,
Yamato Yoshida, Shin Ono

Benzoxaborole is a derivative of phenylboronic acid and has a binding affinity for cis-diol compounds. Recently, benzoxaborole has attracted much attention for its application because of its sugar-binding ability even at neutral pH. We have introduced benzoxaboroles into the Lys side chains of enzymes and investigated the changes in the characteristics of the enzymes. In this study, we introduce several benzoxaboroles into the Lys side chains of chymotrypsin and report the changes in enzymatic activity and properties of the enzyme by adding sugar-binding properties.

Keywords : Benzoxaborole; Chemical modification; Chymotrypsin; Enzymatic activity; Sugar-binding ability

ベンゾキサボロール (benzoxaborole, Bob) は、ガラクトースやマンノースなどのシスジオール構造を持つ化合物に対して、選択的に認識して結合する特性を持っているため、医薬品や糖センサーへの応用が注目されている¹⁾。そこで、タンパク質の Lys 残基にランダムに Bob を導入することで糖鎖を認識する機能を付与し、既知タンパク質の機能を変換する研究を行っている。

今回、Bob のアミノ誘導体 (5-Amino-2-(hydroxymethyl)phenylboronic Acid Cyclic Monoester) をグルタリル化後、N-ヒドロキシサクシンイミド活性エステルに導いた Bob 修飾分子 (Bob-NH-Glt-NHS) を用い、既知タンパク質としてキモトリプシン (Csin) を採用して、Bob 誘導体が結合したランダム Bob (Bob'MCsin) を調製した。得られた Bob'MCsin のペプチド基質に対する加水分解速度は、天然の Csin のものに相当することがわかり、導入された Bob 部分はペプチド基質の加水分解活性には影響しないことが示された。さらに、Bob'MCsin のアガロースゲルやアルギン酸ゲルへの親和性を評価しているので合わせて報告する。



Bob-NH-Glt-NHS の構造

1) Recent Developments in the Chemistry and Biological Applications of Benzoxaboroles. A. Adamczyk-Woźniak, K. M. Borys, A. Sporzyński, *Chem. Rev.* **2015**, *115*, 5224–5247.