

ペプチド合成と精製における最新のイノベーション

ペプチド治療薬に対する世界的な需要の高まりを受け、ペプチド生産の効率性と持続可能性の向上に再び焦点が当てられています。ペプチドスのクリーニングは通常、小型カラムや96ウェルプレートを用いた大規模バッチで実施されます。従来、これらのフォーマットにおける合成プロセスの効率性は、攪拌と高温（マイクロ波エネルギー）を組み込んだ大スケールの反応に比べて著しく低いものでした。我々は、マイクロ波合成用に最適化されたカルボジイミドを用いたカップリングプロセスからの知見と、これらのフォーマットでより高い温度加熱（80℃）を実現するための技術的改良を活用し、プレートと小型カラムの両方におけるペプチドライブラリの純度を向上させました。

マイクロ波エネルギーの利用はペプチド合成の速度と効率に革命をもたらしました。最近では、脱保護剤の塩基の蒸発除去によりSPPS（UE-SPPS）における洗浄ステップを全て排除することで、更に進化を遂げています。加えて最近では、高温下での合成条件改善に関する知見により、ペプチド挿入の削減だけでなく、使用されるアミノ酸の当量の削減も可能になりました。研究開発スケールおよびGLP-1薬剤（リラグルチド210mmol）の生産スケールの両方において、マイクロ波ペプチド合成を用いてこれらの改善を実証しました。

ペプチド精製におけるアセトニトリルに代わるより環境に優しい溶媒の特定が重要視されています。エタノールは理想的な代替品としてその候補に挙げられる一方、その高い粘度が使用を制限していました。このセミナーでは、最適化された手法（新規統合加熱システムを用いた）による高温HPLC精製をご紹介します。この手法により、60℃条件下でエタノールを用いたペプチド精製が可能となり、アセトニトリルを用いた常温条件と比較して平均約50%の回収率向上が達成されました。更に、メタノールで発生が知られているエステル化副反応の可能性について、エタノールを用いた評価を実施し、本手法の堅牢性を確認しました。

2025.10.22 (水) 12:05~13:05

CEM Japan 株式会社

〒108-0074 東京都港区高輪2-18-10

TEL: +81-(0)3-5793-8542

FAX: +81-(0)3-5793-8543

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

E-mail: Info.jp@cem.com

会場: 福岡国際会議場

演者: 横野健、村山薫

(CEM Japan 株式会社)