

Peptidszintézis

SZINTÉZIS ← PROTE(IN)ÁZ → BONTÁS
 -CO-NH- -CO-NH-

$$\text{H}_2\text{N}-\overset{\text{R}_1}{\text{CH}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NH}-\overset{\text{R}_2}{\text{CH}}-\text{COOH} + \text{H}_2\text{O} \xrightleftharpoons{\text{Protease}} \text{H}_2\text{N}-\overset{\text{R}_1}{\text{CH}}-\text{COOH} + \text{H}_2\text{N}-\overset{\text{R}_2}{\text{CH}}-\text{COOH}$$

Minden enzim reakció megfordítható, még a makromolekulákat hidrolizálók is, de csak egy-két kötést hoznak létre, hosszú láncot nem.

BME Alkalmazott Biotechnológia és Élelmiszertudomány Tanszék
1

Bontási hely specifikus prote(in)ázok

Tripszin* (EC 3.4.21.4)	Arg/Lys ↓ Y _{as}
Szubtilizin* (EC 3.4.21.62)	Trp/Tyr/Phe/Leu ↓ Y _{as}
Elasztáz* (EC 3.4.21.36)	Ala/Ser ↓ Y _{as}
Termolizin (EC 3.4.24.27)	X _{as} ↓ Leu/Phe
Pepszin (EC 3.4.23.15)	Phe/Tyr/Leu ↓ Trp/Phe/Tyr

Y_{as}=bármelyik aminosav, -észter vagy -amid
 X_{as}=bármelyik aminosav

BME Alkalmazott Biotechnológia és Élelmiszertudomány Tanszék
2

Védőcsoportok

Melléktermékek elkerülésére a nem-reagáló csoportokat védeni kell

-NH₂ védelme

$$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CO}-\text{NH}-\overset{\text{R}}{\text{CH}}-\text{COOH}$$

Benziloxikarbonil- (Z)

$$\text{CH}_3-\text{CO}-\text{NH}-\overset{\text{R}}{\text{CH}}-\text{COOH}$$

Acetil- (Ac)

-COOH védelme

$$\text{H}_2\text{N}-\overset{\text{R}}{\text{CH}}-\text{CO}-\text{NH}_2$$

Amid-

$$\text{H}_2\text{N}-\overset{\text{R}}{\text{CH}}-\text{CO}-\text{O}-\text{CH}_3$$

Észter

BME Alkalmazott Biotechnológia és Élelmiszertudomány Tanszék
3

Az enzimes eljárás

Az enzim forrása: *Bacillus proteolyticus*
 Izolált enzimként, oldott formában vagy rögzítve alkalmazzák.
 Szekesos eljárás, keverős reaktorban

Előnyei:
 Nem keletkezik β -aszpartám (keserű)
 Sztereoselektív a reakció, csak L-aszpartám keletkezik, enantiomer tisztaság: 99,99 %
 Emiatt alapanyagként DL-Phe (racém) is használható.
 Nincs racemizáció a szintézis alatt

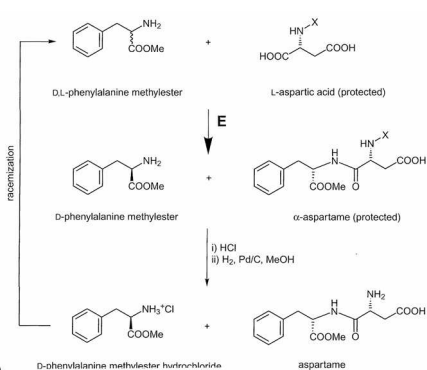


BME Alkalmazott Biotechnológia és Élelmiszertudomány Tanszék

10

A gyártás lépései

1. A keletkező védett aszpartám adduktot képez a feleslegben lévő D-PheOMe-rel, és kicsapódik.
2. Szűrés
3. Sósavval visszaoldják.
4. A BOC csoportot lehidrogénezik, a D-PheOMe-t racemizálják és visszaviszik a folyamat elejére.



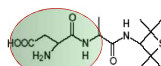
B1

D-phenylalanine methyl ester buten-klorid

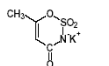
aspartame

További édesítőszer

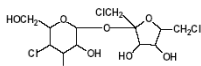
Main intense sweeteners



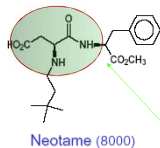
Alitame (2000)



Acesulfame-K (200)



Sucralose (500)



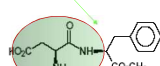
Neotame (8000)



Saccharin (300)



Cyclamate (30)



Aspartame (200)



12
