

多分子連結型 DACN 誘導体の開発とペプチド複合化への応用

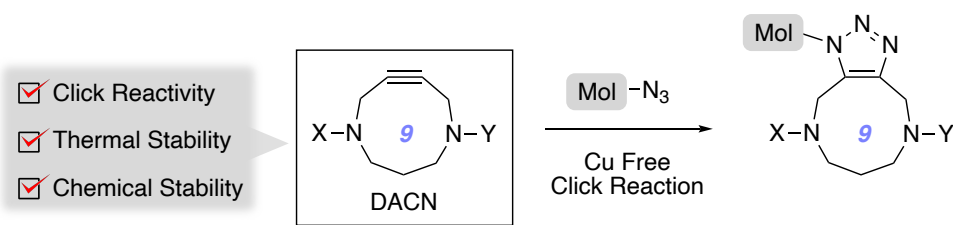
(九大院総理工¹・熊大先端科学²・九大先導研³)

○林原 智也¹・瀬戸 祐樹¹・谷口 優太郎¹・井川 和宣²・河崎 悠也³・友岡 克彦^{1,3}
 Development of DACN based Multi-Molecular Connector and Its Application for Hybridization of Peptides (¹IGSES, Kyushu Univ., ²FAST, Kumamoto Univ., ³IMCE, Kyushu Univ.) ○Tomoya Hayashibara,¹ Yuki Seto,¹ Yutaro Taniguchi,¹ Kazunobu Igawa,² Yuuya Kawasaki,³ Katsuhiko Tomooka^{1,3}

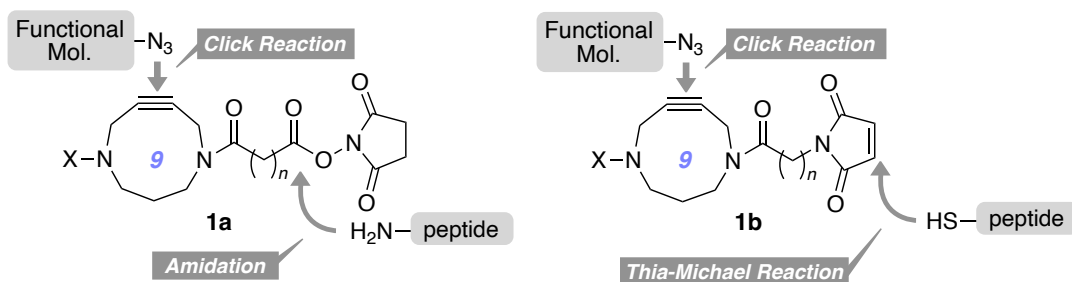
To expand the chemistry of our previously developed 4,8-diazacyclononyne (DACN), we designed and synthesized DACN-NHS ester **1a** and DACN-maleimide **1b**. The details of their synthesis and applications for labeling of peptides will be presented.

Keywords : DACN; Huisgen Reaction; Click Reaction; Labeling Reaction

先に我々は無触媒クリック反応素子 4,8-diazacyclononyne (DACN)を開発し、これが熱的、化学的に安定でありながら高い反応性を有することを明らかにしている。^{1,2,3)}



本研究では DACN を生体分子の高度複合化に利用することを目指して、DACN-NHS エステル **1a**、DACN マレイミド **1b** を開発した。これらは無触媒条件下で アジドと Huisgen 反応するとともに、それぞれアミンとの縮合反応によりアミド結合を形成、もしくは、チオール類との thia-Michael 反応により C-S 結合を形成することができる。発表時には **1a**, **1b** の合成と反応の詳細、およびペプチドの複合化への応用について報告する。



- 1) R. Ni, N. Mitsuda, T. Kashiwagi, K. Igawa, K. Tomooka, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2015**, 54, 1190. 2) K. Igawa, S. Aoyama, Y. Kawasaki, T. Kashiwagi, Y. Seto, R. Ni, N. Mitsuda, K. Tomooka, *Synlett* **2017**, 28, 2110. 3) Y. Kawasaki, Y. Yamanaka, Y. Seto, K. Igawa, K. Tomooka, *Chem. Lett.* **2019**, 48, 495.