

生体適合触媒反応を指向した臭素化剤の開発

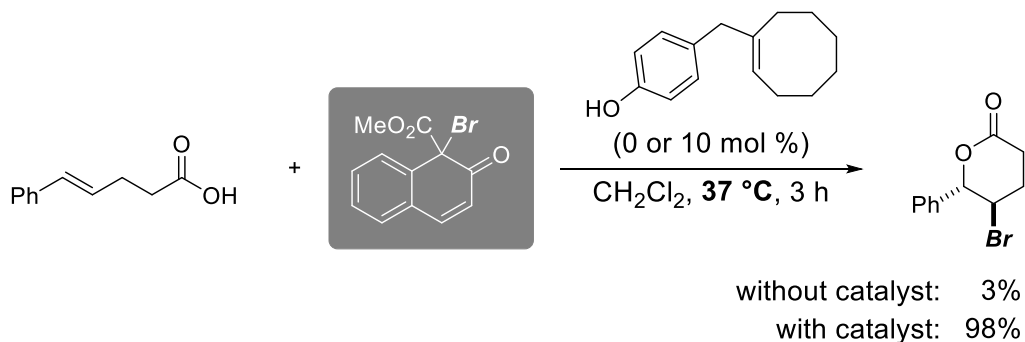
(京大院工) ○吉田 楽人・長野 倫・村田 竜一・浅野 圭佑・松原 誠二郎

Development of Biocompatible Brominating Reagents (*Graduate School of Engineering, Kyoto University*) ○Rakuto Yoshida, Tagui Nagano, Ryuichi Murata, Keisuke Asano, Seijiro Matsubara

We previously developed cyclooctene catalysts, which have high catalytic activity in halogenation reactions.¹ In addition, on the basis of the established chemistry as bioconjugation tags,² the cyclooctenes are recognized as biocompatible structures. Thus, we are currently trying to use the cyclooctene catalysts for biocompatible halogenation. However, *N*-haloamide reagents are too reactive to carry out catalyst-controlled halogenation at biocompatible temperatures. In this study, biocompatible brominating reagents were developed. They were stable at biocompatible temperatures, while they are reactive in the presence of the cyclooctene catalysts.

Keywords : *Brominating Reagent; Cyclooctene; Biocompatible Reaction; Catalytic Control*

我々は、ハロゲン化反応において高い活性を示すシクロオクテン触媒を既に開発した¹。また、生体共役反応性タグ²としてしばしば利用されるシクロオクテン構造は生体適合性にも優れるため、現在、シクロオクテン触媒による生体適合ハロゲン化反応の開発を目指している。しかし、*N*-ハロアミド反応剤は反応性が高過ぎるため、生体適合温度におけるハロゲン化反応の触媒制御は実現できない。本研究では、生体適合反応に利用できる温度で十分な安定性を持ちながら、シクロオクテン触媒により速やかに反応する生体適合性の高い臭素化剤を開発した。



1) S. Einaru, K. Shitamichi, T. Nagano, A. Matsumoto, K. Asano, S. Matsubara, *Angew. Chem., Int. Ed.* **2018**, 57, 13863.

2) N. K. Devaraj, R. Weissleder, R. *Acc. Chem. Res.* **2011**, 44, 816.