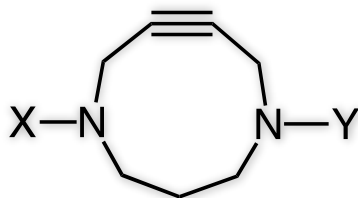


無触媒クリック反応素子

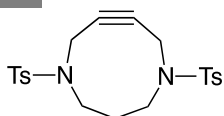
高機能性アルキン DACN



DACN
(4,8-diazacyclononyne)

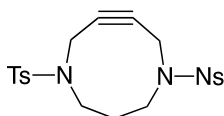
九州大学・先導物質化学研究所の友岡, 井川, 河崎らによって開発された無触媒クリック反応素子(DACN)の誘導体として新たに, NHSエステルやマレイミドなどの連結部位を有する新分子が加わりました。これら新しいDACN誘導体では, アルキン部位でのHuisgen反応による分子連結とともに, もう一箇所での分子連結を相互に干渉することなく簡便に行うことができます。ペプチド工学, タンパク質・抗体工学, 糖鎖工学, 核酸工学, 錯体化学, 機能性分子の合成などの多様な分野でご利用頂けます。

従来品



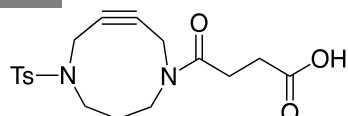
NTs,NTs-DACN

従来品



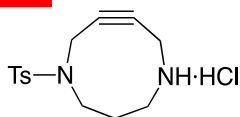
MNs,NTs-DACN

従来品



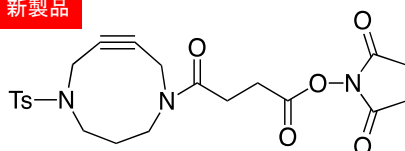
NSu,NTs-DACN

新製品



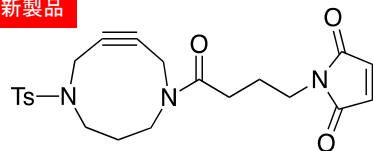
MH,NTs-DACN·HCl

新製品



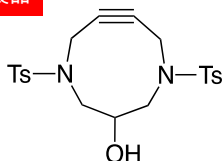
NSu,NTs-DACN NHS ester

新製品



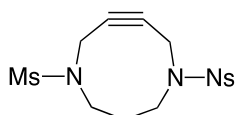
MMal,NTs-DACN

新製品



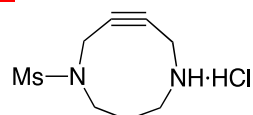
NTs,NTs-DACN-OH

新製品



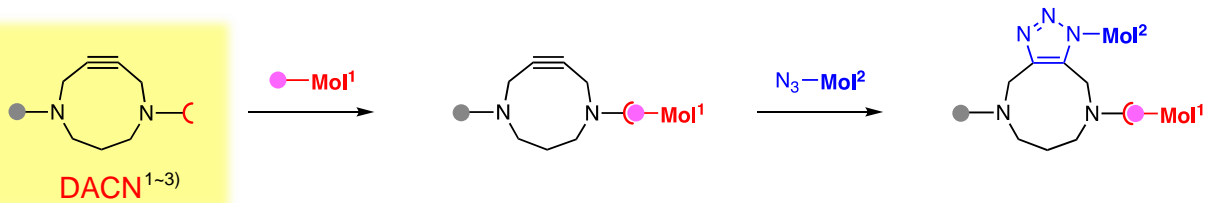
MNs,MMs-DACN

新製品



MH,MMs-DACN·HCl

基本特性



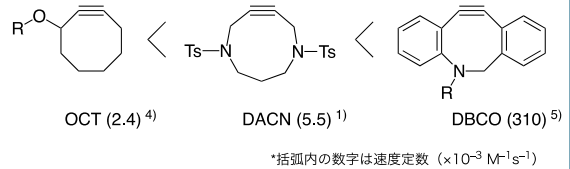
- 良好なクリック反応性 (OCTの約2倍: 右図参照)¹⁾
- OCTやDBC0の問題を解決

高い熱安定性²⁾: 取り扱いが容易, 加熱条件下での反応実施可

チオールに対する低反応性²⁾: システインやグルタチオン等, 生体チオールの共存可

低疎水性 (MMs-DACNシリーズ)³⁾: 水溶性向上, タンパク質の非特異吸着を抑制

ベンジリアジドとのクリック反応速度の比較



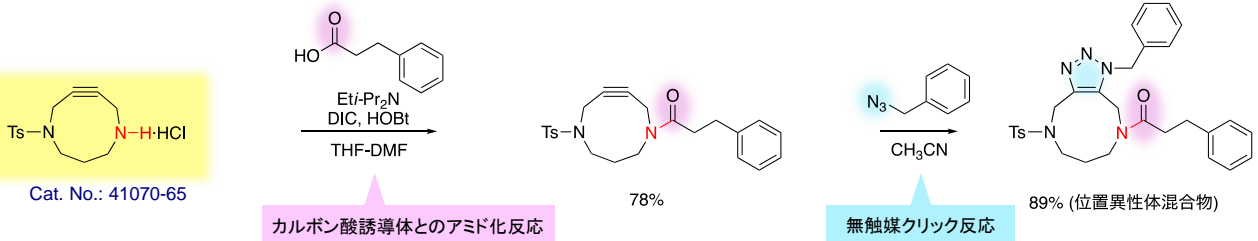
1) K. Igawa, K. Tomooka, *et al*, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2015**, *54*, 1190. 2) K. Igawa, Y. Kawasaki, K. Tomooka, *et al*, *Synlett* **2017**, 28, 2110.

3) Y. Kawasaki, K. Igawa, K. Tomooka, *et al*, *Chem. Lett.* **2019**, 48, 495. 4) C. R. Bertozzi, *et al*, *J. Am. Chem. Soc.* **2004**, 126, 15046.

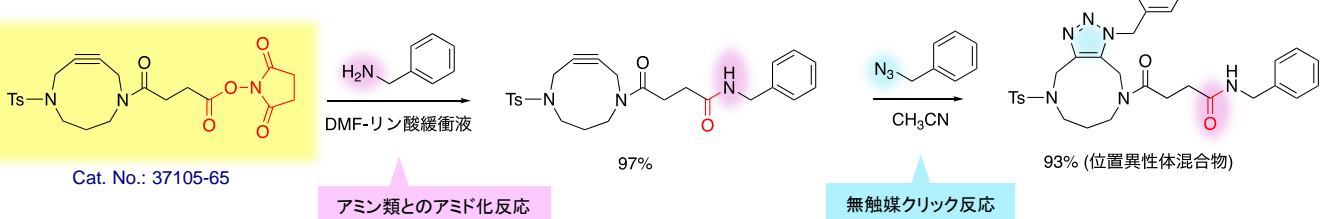
5) F. L. van Delft, *et al*, *Chem. Commun.* **2010**, 46, 97.

基本反応例

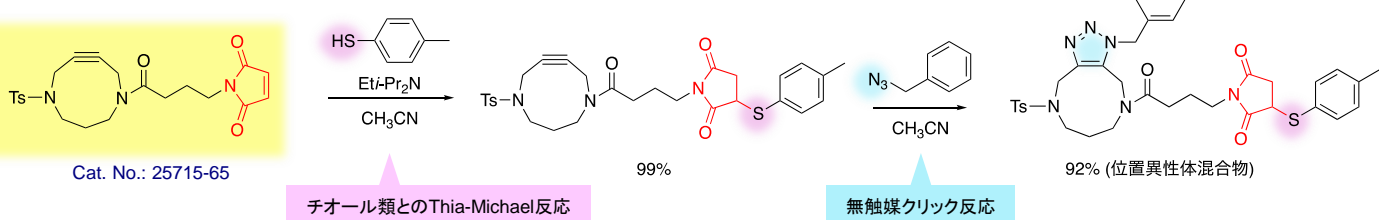
MH-DACNを用いた分子連結



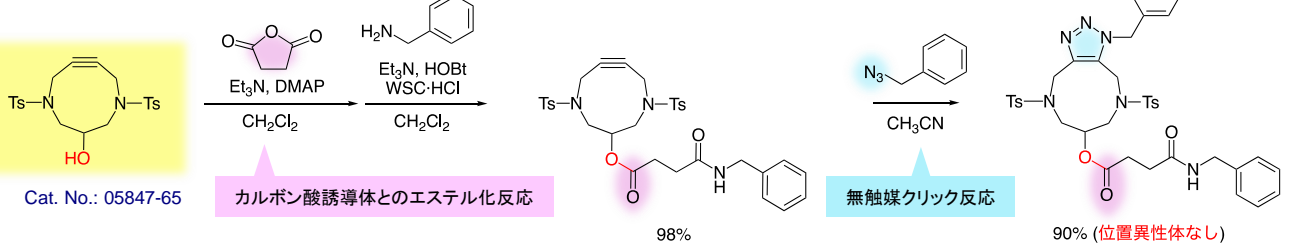
NSu-DACN NHS esterを用いた分子連結



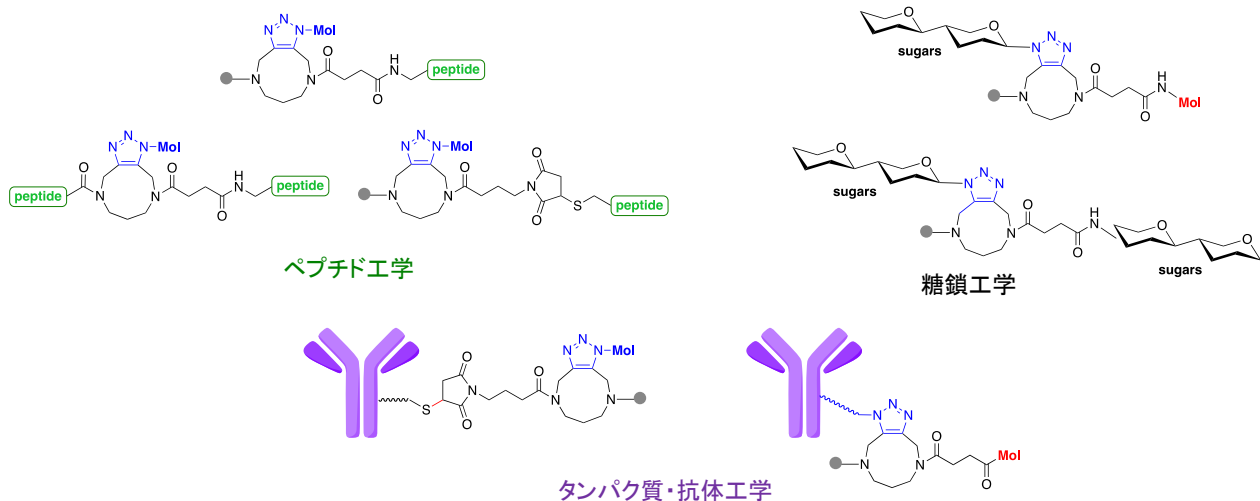
MMal-DACNを用いた分子連結



DACN-OHを用いた分子連結

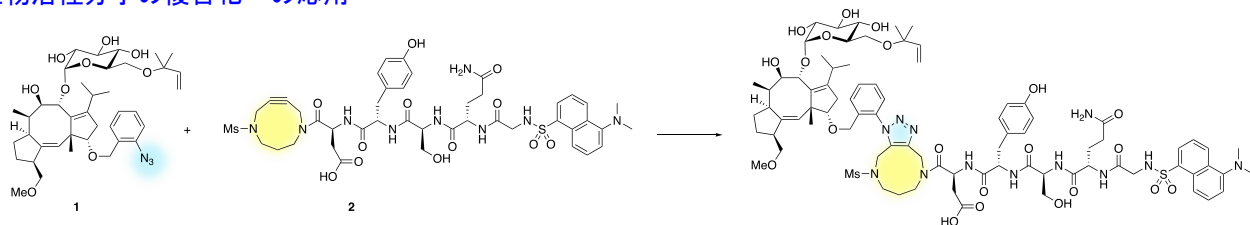


用途例



応用例

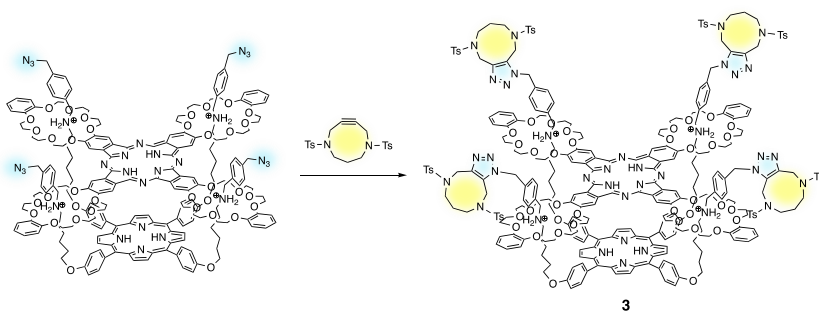
生物活性分子の複合化への応用



蛋白質-蛋白質相互作用に関わるフシコクシン誘導体**1**とペプチド**2**の複合化。細胞内での複合化も可。

J. Ohkanda, *et al. Chem. Asian. J.* **2020**, *15*, 742.

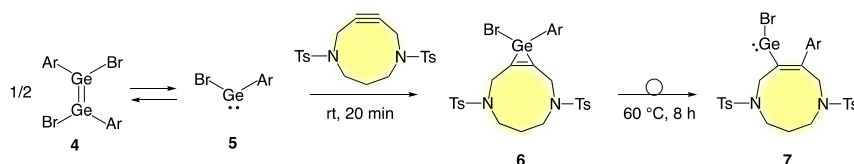
機能性分子合成への応用: 4重ロタキサン留め具としての利用



超分子触媒の骨格となるポルフィリン・フタロシアニンの4重ロタキサン**3**の合成。4ヶ所のアジドとDACNの無触媒クリック反応でロタキサンの末端を一挙に固定。無触媒反応であるために、ポルフィリン・フタロシアニンへの触媒金属の取り込みを回避。

Y. Yamada, K. Tanaka, *et al. Chem. Eur. J.* **2017**, *23*, 7508.

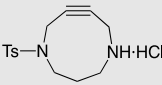
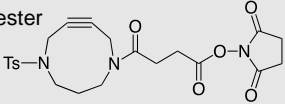
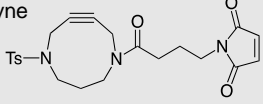
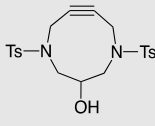
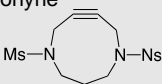
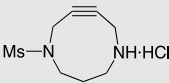
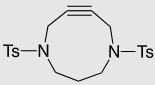
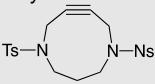
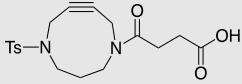
反応機構研究への応用



ジゲルメン**4**から生じるゲルミレン**5**と反応して一次生成物**6**を与える。また**6**は熱転位してゲルミレン**7**を与える。

T. Sasamori, *et al. Dalton Trans.* **2020**, *49*, 7189.

製品リスト

| 製品名 | 製品番号 | 包装 | 価格(¥) | |
|--|------|----------|--------|--------|
| <p><i>N</i>-<i>p</i>-トルエンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン塩酸塩 <i>N</i>-<i>p</i>-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne hydrochloride CAS RN®: 2331322-18-8 略称 : MH, NTs-DACN・HCl FW : 314.83</p>  | 新製品 | 41070-65 | 25 mg | 15,000 |
| <p><i>N</i>-スクシノイル-<i>N'</i>-<i>p</i>-トルエンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン NHSエステル <i>N</i>-succinoyl-<i>N'</i>-<i>p</i>-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne NHS ester CAS RN®: - 略称 : NSu, NTs-DACN NHS Ester FW : 475.52</p>  | 新製品 | 37105-65 | 25 mg | 15,000 |
| <p><i>N</i>-4-マレイミドブチリル-<i>N'</i>-<i>p</i>-トルエンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン <i>N</i>-4-maleimidobutryl-<i>N'</i>-<i>p</i>-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne CAS RN®: - 略称 : MMal, NTs-DACN FW : 443.52</p>  | 新製品 | 25715-65 | 25 mg | 15,000 |
| <p><i>N,N'</i>-ビス(<i>p</i>-トルエンスルホニル)-6-ヒドロキシ-4,8-ジアザシクロノニン <i>N,N'</i>-bis(<i>p</i>-toluenesulfonyl)-6-hydroxy-4,8-diazacyclononyne CAS RN®: 2109751-74-6 略称 : NTs, NTs-DACN-OH FW : 448.55</p>  | 新製品 | 05847-65 | 25 mg | 10,000 |
| <p><i>N</i>-メタンスルホニル-<i>N'</i>-<i>o</i>-ニトロベンゼンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン <i>N</i>-methanesulfonyl-<i>N'</i>-<i>o</i>-nitrobenzenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne CAS RN®: 2411082-25-0 略称 : MMs, NNs-DACN FW : 387.43</p>  | 新製品 | 25716-65 | 25 mg | 10,000 |
| <p><i>N</i>-メタンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン塩酸塩 <i>N</i>-methanesulfonyl-4,8-diazacyclononyne hydrochloride CAS RN®: 2331322-16-6 略称 : MH, MMs-DACN・HCl FW : 238.73</p>  | 新製品 | 25717-65 | 25 mg | 20,000 |
| <p><i>N,N'</i>-ビス(<i>p</i>-トルエンスルホニル)-4,8-ジアザシクロノニン <i>N,N'</i>-bis(<i>p</i>-toluenesulfonyl)-4,8-diazacyclononyne CAS RN®: 1797508-57-6 略称 : NTs, NTs-DACN FW : 432.55</p>  | 従来品 | 05628-68 | 100 mg | 15,000 |
| | | 05628-65 | 25 mg | 6,500 |
| <p><i>N</i>-<i>o</i>-ニトロベンゼンスルホニル-<i>N'</i>-<i>p</i>-トルエンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン <i>N</i>-<i>o</i>-nitrobenzenesulfonyl-<i>N'</i>-<i>p</i>-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne CAS RN®: 1797508-58-7 略称 : MNs, NTs-DACN FW : 463.52</p>  | 従来品 | 28197-68 | 100 mg | 17,500 |
| | | 28197-65 | 25 mg | 8,000 |
| <p><i>N</i>-スクシノイル-<i>N'</i>-<i>p</i>-トルエンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン <i>N</i>-succinoyl-<i>N'</i>-<i>p</i>-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne CAS RN®: 2109751-68-8 略称 : NSu, NTs-DACN FW : 378.44</p>  | 従来品 | 37104-68 | 100 mg | 27,000 |
| | | 37104-65 | 25 mg | 9,500 |

Ts : *p*-toluenesulfonyl Ns : *o*-nitrobenzenesulfonyl Ms : methanesulfonyl

大量供給などのご要望につきましては弊社支店・営業所へご相談下さい。
 本リーフレットの内容および価格・仕様は予告なく変更する場合がございます。
 最新の情報は弊社カタログ検索サイト[Cica-web]にてご確認ください。

 関東化学株式会社

試薬事業本部 試薬部

〒103-0022 東京都中央区日本橋室町2丁目2番1号

TEL: 03-6214-1090

HP: <https://www.kanto.co.jp>

OAI-01 (202007)