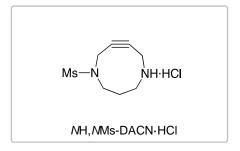
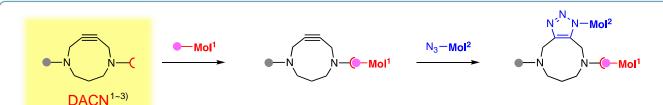
高機能性アルキン DACN



九州大学・先導物質化学研究所の友岡克彦教授、井川和宣助教(現 熊本大学教授)、河崎悠也特任助教 (現 助教)らによって開発された無触媒クリック反応素子(DACN)の誘導体を販売しています。特に、NHSエステルやマレイミドなどの連結部位を有する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。ペプチドエ学、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。

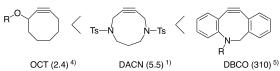




- ・良好なクリック反応性(OCTの約2倍:右図参照)¹⁾
- ・OCTやDBCOの問題を解決 高い熱安定性2):取り扱いが容易,加熱条件での反応実施可 チオールに対する低反応性2):システインやグルタチオン等,生体チオールの共存可

低疎水性(AMs-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

ベンジルアジドとのクリック反応速度の比較



*括弧内の数字は速度定数(×10⁻³ M⁻¹s⁻¹)

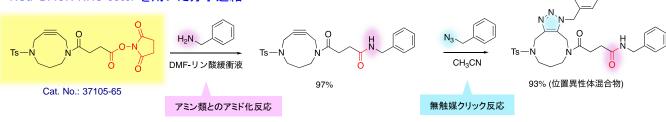
- 1) K. Igawa, K. Tomooka, et al, Angew. Chem. Int. Ed. 2015, 54, 1190. 2) K. Igawa, Y. Kawasaki, K. Tomooka, et al, Synlett 2017, 28, 2110.
- 3) Y. Kawasaki, K. Igawa, K. Tomooka, et al, Chem. Lett. **2019**, 48, 495. 4) C. R. Bertozzi, et al, J. Am. Chem. Soc. **2004**, 126, 15046. 5) F. L. van Delft, et al, Chem. Commun. **2010**, 46, 97.

基本反応例

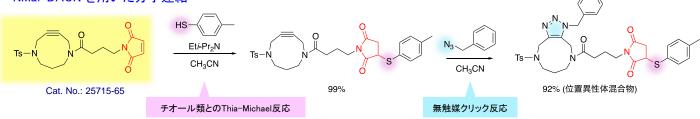
MH-DACNを用いた分子連結



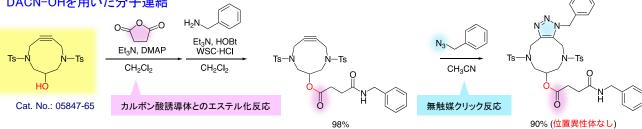
MSu-DACN NHS ester を用いた分子連結



MMal-DACN を用いた分子連結



DACN-OHを用いた分子連結



用途例

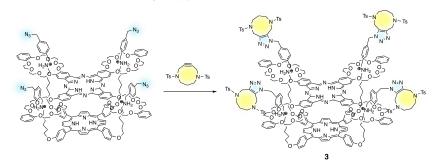
応用例

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重ロタキサンの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. Darton Trans. 2020, 49, 7189.



製品リスト

製 品 名	製品番号	包 装
N-p-トルエンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン塩酸塩 N-p-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne hydrochloride CAS RN®: 2331322-18-8 略称 : NH,NTs-DACN・HCI FW : 314.83	41070-65	25 mg
N-スクシノイル-N'-p-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 N-succinoyl-N-p-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne NHS ester CAS RN®:— 略称 : NSu,NTs-DACN NHS Ester FW : 475.52	<u>37105-65</u>	25 mg
N-4-マレイミドブチリル-N'-p-トルエンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン N-4-maleimidobutyryl-N-p-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne CAS RN®:— 略称 : NMal,NTs-DACN FW : 443.52	<u>25715-65</u>	25 mg
N,N ⁻ ビス(p-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 N,N-bis(p-toluenesulfonyl)-6-hydroxy-4,8-diazacyclononyne CAS RN®:2109751-74-6 略称 :NTs,NTs-DACN-OH FW :448.55	<u>05847-65</u>	25 mg
N-メタンスルホニル-N'-o-ニトロベンゼンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン N-methanesulfonyl-N-o-nitrobenzenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne CAS RN®: 2411082-25-0 略称 : Ms,NNs-DACN FW : 387.43	<u>25716-65</u>	25 mg
N-メタンスルホニル-4,8-ジアザシクロノニン塩酸塩 N-methanesulfonyl-4,8-diazacyclononyne hydrochloride CAS RN®: 2331322-16-6 略称 : NH,NMs-DACN・HCI FW : 238.73	<u>25717-65</u>	25 mg
N,N'-ビス(p-トルエンスルホニル)-4,8-ジアザシクロノニン N,N-bis(p-toluenesulfonyl)-4,8-diazacyclononyne	05628-68	100 mg
CAS RN [®] : 1797508-57-6 Ts—N N—Ts 略称 : NTs,NTs-DACN FW : 432.55	05628-65	25 mg
N-o-ニトロベンゼンスルホニル−N'-p-トルエンスルホニル−4,8−ジアザシクロノニン N-o-nitrobenzenesulfonyl-N-p-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne	28197-68	100 mg
CAS RN [®] : 1797508-58-7 略称 : NNs,NTs-DACN FW : 463.52	<u>28197-65</u>	25 mg
N−スクシノイル−N'-p-トルエンスルホニル−4,8−ジアザシクロノニン N-succinoyl-N-p-toluenesulfonyl-4,8-diazacyclononyne	37104-68	100 mg
CAS RN [®] : 2109751-68-8 略称 : <i>N</i> Su, <i>N</i> Ts-DACN FW : 378.44	<u>37104-65</u>	25 mg

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。

- 本記載の製品は、試薬(試験、研究用として用いる化学薬品)としての用途にご利用ください。
- 本記載の製品情報は予告なく変更する場合があります。 最新情報は、弊社ホームページ「Cica-Web」をご確認ください。



三 関東化学株式会社

試薬事業本部

〒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 (202405)