



クリック反応素子 DACN の効率的合成法とその多機能化 Efficient Synthesis and Multi-functionalization of DACN for Versatile Click Chemistry

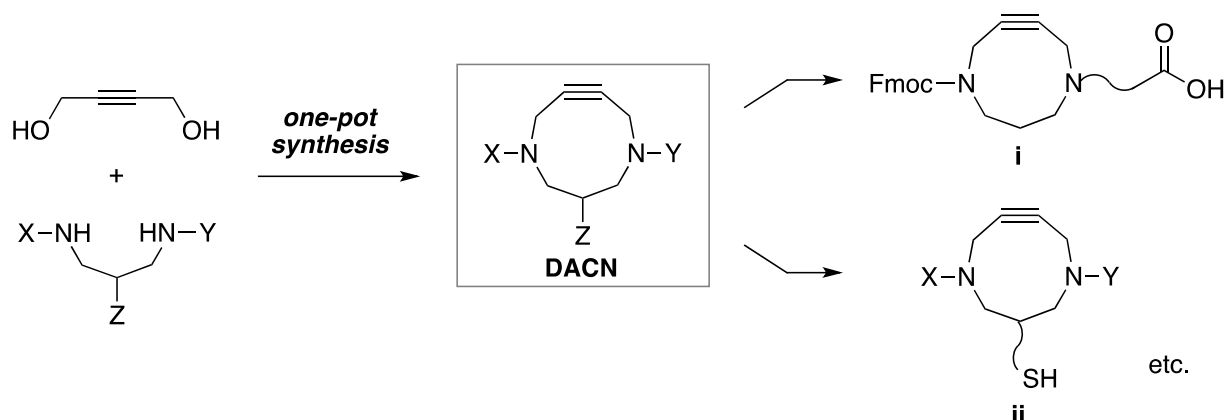
河崎悠也¹, 瀬戸祐樹², 青山慎², 井川和宣^{1,2}, 友岡克彦^{1,2}
(九大先導研¹, 九大院総理工²)

高度に歪んだシクロオクチン誘導体とアジドの Huisgen 反応は、銅触媒なしで迅速に進行することから「Cu free click reaction」として様々な分野で利用されている¹。しかしながら、シクロオクチン誘導体は安定性に乏しく、それゆえに、保存時や実験操作中の分解、生体中での副反応、導入可能な機能性分子が制限されるなどの多くの問題を有している。

これに対して当研究室では、最近、新たなクリック反応素子として、9 員環アルキン 4,8-diazo-cyclononyne (DACN)を開発するとともに、DACN が熱的、化学的に安定でありながら無触媒条件下で十分なクリック反応性を示すことを明らかにしている²。

今回、DACN のさらなる応用展開を目的として、高効率なワンポット合成法を開発するとともに³、多機能化された新規 DACN 誘導体の合成について検討を行い、固相合成法でペプチド鎖へ導入できる「Fmoc アミノ酸型 DACN」**i**、分子連結に有用な「メルカプト基を有する DACN」**ii** などの開発に成功した。

発表時には、ワンポット合成法の詳細を示すとともに、新規 DACN 誘導体 **i**, **ii** などの反応についても言及する。



<参考文献>

- 1) J. C. Jewett, C. R. Bertozzi, *Chem. Soc. Rev.* **2010**, 39, 1272.
- 2) R. Ni, N. Mitsuda, T. Kashiwagi, K. Igawa, K. Tomooka, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2015**, 54, 1190.
- 3) K. Igawa, S. Aoyama, Y. Kawasaki, T. Kashiwagi, Y. Seto, R. Ni, N. Mitsuda, K. Tomooka, *submitted*.

発表者紹介

氏名 瀬戸 祐樹 (せと ゆうき)
所属 九州大学 大学院総合理工学府
物質理工学専攻
学年 M1
研究室 友岡研究室

