



## 九州大学発の9員環アルキン DACN が製品化へ ～様々な環境下での分子連結法としての応用に期待～

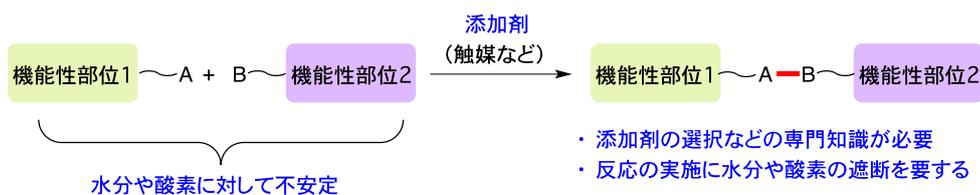
### 概要

九州大学先導物質化学研究所の友岡克彦教授、井川和宣助教らの研究グループは、これまでに高い反応性と高機能性を併せ持つ新型アルキンの開発に成功していました ([2014年12月4日付けプレスリリース参照](#))。今回、それらの新型アルキンの中から9員環アルキン類 4,8-diazacyclononyne (DACN) が「高機能クリック反応素子」として関東化学株式会社から販売されることになりました。DACN は各種アジドと迅速かつ高選択的に反応することから、様々な環境下で複数の分子を連結するためのクリック反応素子として幅広い応用が期待されています。

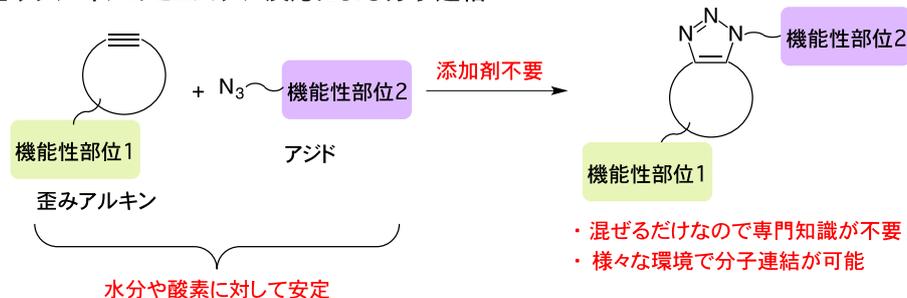
### 背景

複数の機能を有する物質を創製する手法の一つとして、それぞれの機能を有する複数の分子を化学反応によって連結する手法があります。しかしながら、一般的な化学反応の実施には添加剤の選択などの専門的な知識が必要であり、また、活性な化学種が水分や酸素と容易に反応することも多く、それ故に実施環境が制限されることが大きな問題でした (図 1-a)。これに対して、ただ混ぜるだけで迅速かつ高選択的に反応する歪みアルキン (※1) とアジド (※2) のヒュスゲン反応 (※3) が、効率的な分子連結法 (クリック反応) (※4) として注目されています (図 1-b)。このような反応はフラスコの中だけでなく、生きた細胞や高分子材料の中などの様々な環境下での分子連結を可能にすることから、生化学研究や材料開発研究など、幅広い研究分野での応用が期待できます。それ故に、これまで高度に歪んだ8員環アルキン類がクリック反応素子として市販され、様々な研究分野で利用されていますが、それらは化学的に不安定であり、保存や実験操作の過程で熱分解や副反応を生じるなどの欠点がありました。

#### a) 一般的な化学反応による分子連結



#### b) 歪みアルキンのヒュスゲン反応による分子連結



#### 問題点

従来の歪みアルキンの多くは化学的に不安定

図 1 化学反応による分子連結

## ■内 容

本研究グループが開発した9員環アルキン「DACN」は、十分に高いクリック反応性を持ちながら、従来から市販されている歪みアルキンに比べて高い化学的安定性と反応の選択性を示します。また、9員環を構成する窒素原子に様々な機能性部位を導入することで、高度に多機能化された分子の合成に応用することが可能です。これらの利点から、関東化学株式会社ではDACNの製品化を検討し、2016年4月1日（金）から販売を開始します。今回販売されるDACNは、窒素上の置換基が異なるNTs,NTs-DACN、MNs,NTs-DACN、NSu,NTs-DACNの3種類です（図2）。

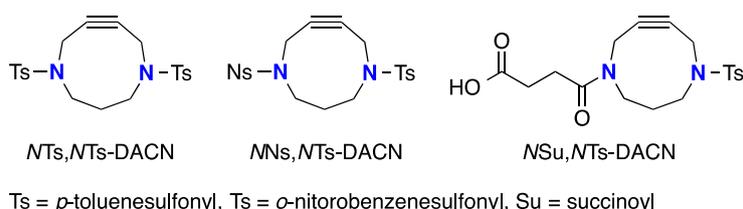


図2 関東化学株式会社から販売されるDACN

## ■効果・今後の展開

今後、環内の二つの窒素にそれぞれ機能性部位を導入することのできるDACNや、よりクリック反応性の高い4-aza-8-oxa-cyclononyne (AOCN)などの販売も予定されています。

### 【用語解説】

(※1) 歪みアルキン：8～10個程度の原子で構成された環状の分子骨格に炭素-炭素三重結合（アルキン）が組み込まれた分子。本来、直線構造が安定なアルキンが曲がっているために歪みアルキンと称される。

(※2) アジド（azide）：アジ基（-N<sub>3</sub>）を有する分子。

(※3) ヒュスゲン反応（Huisgen reaction）：アルキンとアジドの[3+2]双極子環化付加反応。反応生成物として1,2,3-トリアゾールが得られる。歪みの無い鎖状アルキンの反応では銅触媒が必要となる。

(※4) クリック反応（click reaction）：シートベルトのバックルをカチッととめる様に、二つの分子間で迅速に結合を作ることのできる化学反応。多様な分子を簡便に合成する手法として、様々な研究分野で利用されている。

### 【お問い合わせ】

先導物質化学研究所

教授 友岡 克彦（ともおか かつひこ）

電話：092-583-7806

FAX：092-583-7810

Mail：[ktomooka@cm.kyushu-u.ac.jp](mailto:ktomooka@cm.kyushu-u.ac.jp)

先導物質化学研究所

助教 井川 和宣（いがわ かずのぶ）

電話：092-583-7809

FAX：092-583-7810

Mail：[kigawa@cm.kyushu-u.ac.jp](mailto:kigawa@cm.kyushu-u.ac.jp)