

**PRESS RELEASE (2020/08/19)**

**九州大学発の分子連結素子「DACN」に新製品  
～医薬品や機能性材料の開発研究、製造での利用を期待～**

先に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、河崎悠也特任助教らの研究グループは、分子を簡単に連結させる「クリック反応素子」として有用な含窒素 9 員環アルキン (DACN) の開発に成功しています。

今回、同研究グループは DACN に NHS エステルやマレイミドなどの分子連結部位を導入した誘導体や、疎水性を抑えた誘導体など、新たに 6 種類の DACN を開発し、それらが関東化学株式会社から発売されることになりました。これらの DACN は、医薬品や機能性材料の開発研究、製造への利用が期待されます。

**研究者からひとこと**：新たに開発した 6 種類の DACN はタンパク質やペプチドなどの生体分子に簡単に導入することができます。新型ウイルス関連研究への応用も期待できます。

**■背景**

友岡研究室で開発された 4,8-diazacyclononyne (DACN) はアジド (※1) と特異的に、かつ、迅速に反応して結合形成することから、ただ混ぜるだけで 2 つの分子を連結することのできる「無触媒クリック反応素子」(※2) として有用であり、基本的な 3 種類の DACN が関東化学株式会社から販売されています (図 1) ([2014 年 12 月 4 日付けプレスリリース](#)、および [2016 年 3 月 8 日付けプレスリリース](#) 参照)。

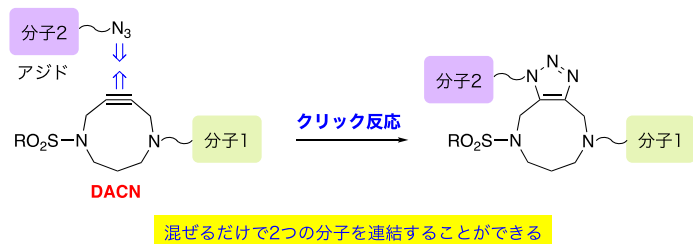


図1 DACNとアジドとの無触媒クリック反応

今回、分子連結部位として有用な NHS エステルとマレイミドが組み込まれた DACN や、疎水性を抑えた DACN など、新たに 6 種類の DACN が同社から発売されました (図 2)。これらの DACN には生体分子 (タンパク質・ペプチド、糖鎖、核酸など)、医薬品の標識化や複合化、また、機能性材料の合成など、幅広い分野での応用が期待されます。なお、その製品化には九州大学が出願中の特許技術 (特開 2020-026476) が使用されています。

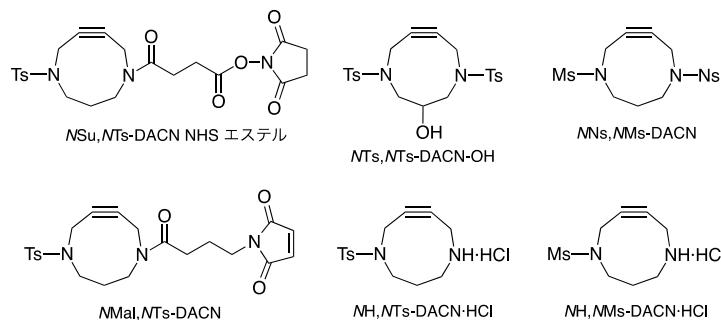


図2 新たに発売されるDACNの一覧

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

(※2) 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】** 九州大学先導物質化学研究所 教授 友岡克彦、助教 井川和宣  
TEL：092-583-7806 FAX：092-583-7810  
Mail：ktomooka@cm.kyushu-u.ac.jp

## ■ 内 容

今回、新たに発売される NSu,NTs-DACN NHS エステルはアミノ基 (-NH<sub>2</sub>) を有する分子にアミド化反応 [図 3(a)] で、MMal,NTs-DACN はメルカプト基 (-SH) を有する分子に thia-Michael 反応 [図 3(b)] で、それぞれ導入することができます。MH,NTs-DACN·HCl、NTs,NTs-DACN-OH はカルボキシ基を有する分子にそれぞれアミド化反応 [図 3(c)]、エステル化反応 [図 3(d)] で導入できます。なお、NTs,NTs-DACN-OH は対称構造のために、クリック反応で位置異性体が生じないという利点も兼ね備えています。

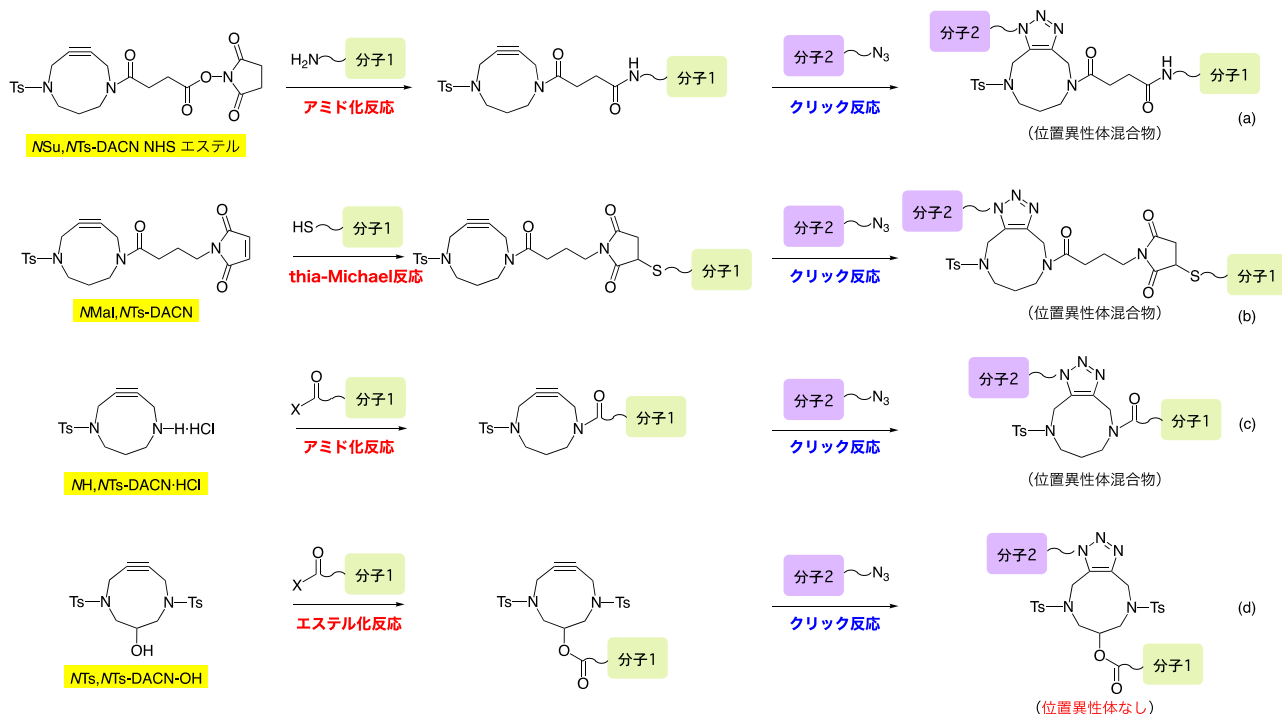


図3 新たに発売されるDACNを用いた分子連結

また今回、DACNの窒素上にメタンサルホニル基 (Ms基) を導入した MMs-DACN が発売されます (図 4)。これまでに製品化されていた DACN は、いずれも、一方の窒素上に *p*-トルエンサルホニル基 (Ts基) が導入されていました。Ts基は紫外光の吸収が大きくそれによる検出が容易であるという利点がありますが、疎水性が高く嵩高いことが問題でした。これに対して今回、MMs-DACN では従来の Ts基を Ms基に代えることで疎水性と嵩高さを顕著に下げることが成功しました。

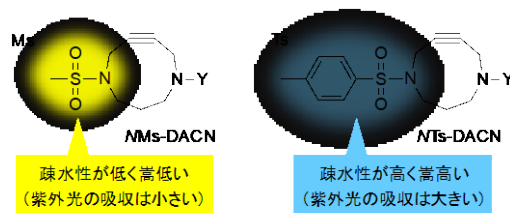


図4 MMs-DACNとNTs-DACNの違い

これら多様な誘導体が供給されることにより、DACNの利用が広がると期待されます。

## ■ 製品情報

関東化学株式会社 URL【無触媒クリック反応素子 高機能アルキン (DACN)】

[https://products.kanto.co.jp/web/index.cgi?c=t\\_product\\_table&pk=142&ga=2.225615770.169545413.1594861949-1655240115.1495089823](https://products.kanto.co.jp/web/index.cgi?c=t_product_table&pk=142&ga=2.225615770.169545413.1594861949-1655240115.1495089823)

## ■ 関連論文情報

題 目 : Synthesis of MMs-DACN: Small and Hydrophilic Click Reaction Device

著 者 : Yuuya Kawasaki, Yuki Yamanaka, Yuki Seto, Kazunobu Igawa, Katsuhiko Tomooka

雑誌名 : Chemistry Letters

D O I : 10.1246/cl.190026