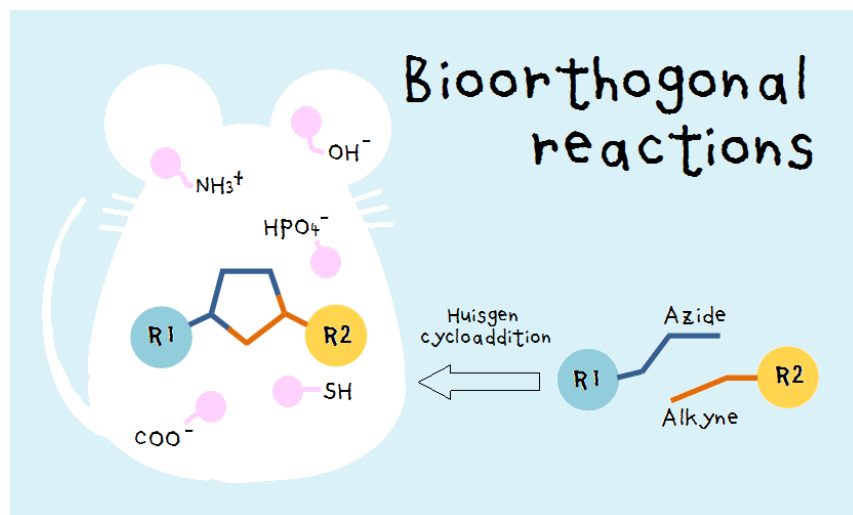


付加環化反応で機能性分子を創り出す

「クリックケミストリー④」



今回は「Bioorthogonal Reactions (生体直行型反応)」について触れたいと思います。

前回、「銅イオンフリー」のクリックケミストリーを題材としました。銅(I)イオン触媒下で加速して進行するクリックケミストリー-Huisgen 反応ですが、アルキンの代わりにシクロオクチン (DBCO) 修飾を利用したり、THPTA を添加することで、銅(I)イオン毒性の懸念を解消できることをご紹介しました。

それではなぜ、銅イオンフリーHuisgen 反応が注目されるのでしょうか。

それは、Huisgen 反応が生体直行型反応だからです。「Bioorthogonal Reactions (生体直行型反応)」とは、お互いの間にだけ起こる、生物学的な系では唯一の反応であるということを表しています。例えば NHS-ester は、DNA またはタンパク質に見られるアミノ基を標識する可能性が、また、チオール基はタンパク質中のスルフヒドリル基と反応する可能性があります。ところが、クリックケミストリー-Huisgen 反応では、アルキンもアジドも生物学的な系において通常見られない官能基で、生体内での交差反応が起こりません。加えて、アルキンやアジド自体が細胞に与える毒性はないと言われていることから、生体内における特異的な反応には、銅イオンフリーHuisgen 反応は非常に有用であると考えられているのです。

▶▶今回も「Bioorthogonal Reactions (生体直行型反応)」に関するレビューをご紹介します。本レビューでは、生体における選択的な反応が困難でありながらも求められる理由とその魅力について、生体直行型反応の重要性と関連させながら述べられています。また、レビューの後半には、生体におけるシクロオクチンを用いた銅イオンフリー反応の応用例が記載されています。バクテリオファージの蛍光ラベル、タンパク質へのアジド導入と蛍光ラベル、タンパク質-タンパク質相互作用の研究、細胞の画像解析など、幅広く紹介されていますので、参考になるアプリケーション例が見つければ幸いです。

Cu-free click cycloaddition reactions in chemical biology, Chem Soc Rev. 2010 Apr; 39(4): 1272–1279.

日本遺伝子研究所では、クリックケミストリー-Huisgen 反応用の修飾オリゴ DNA 合成を承っております。

▶アジド(-N₃)修飾オリゴ DNA

▶アルキン(-CECH)修飾オリゴ DNA

NEW! ▶シクロオクチン(DBCO:dibenzocyclooctyl)修飾オリゴ DNA

⇒詳細は[こちら](#)