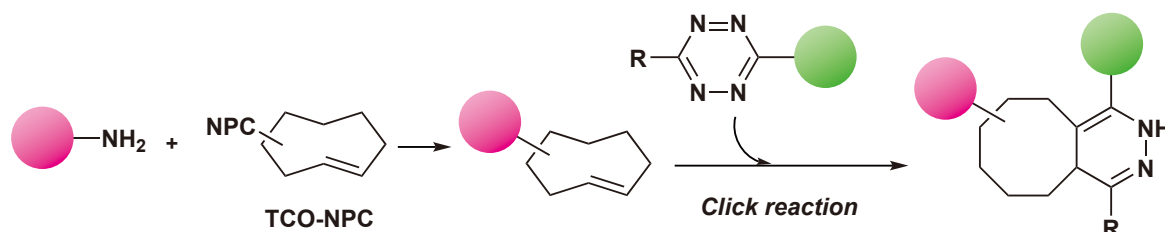
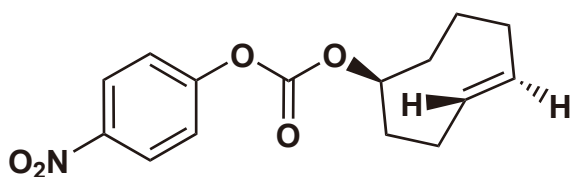


# テトラジン類と選択的に反応する コンジュゲーション試薬



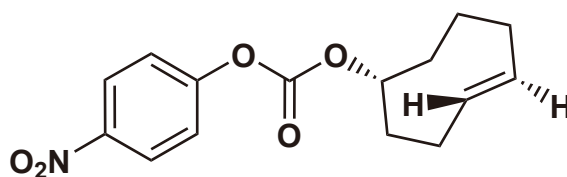
TCO (*trans*-シクロオクテン)は、テトラジン類と歪み促進逆電子要請型Diels-Alder反応 (SPIEDAC)をして、共有結合を形成します。この反応は、様々な官能基存在下においても選択的に進行し、クリックケミストリーとして使用されています。TCOを使用したクリックケミストリーは、生体共役反応としての基準 (高速、選択性、生体適合性、無触媒) を満たすため、タンパク質標識やイメージングなどに広く利用されています<sup>1,2,3,4)</sup>。



**TCO-NPC Equatorial Isomer**

100mg 13,100円

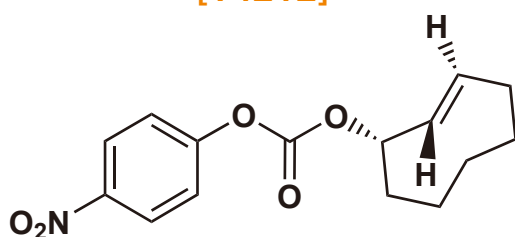
[T4212]



**TCO-NPC Axial Isomer**

100mg 15,500円

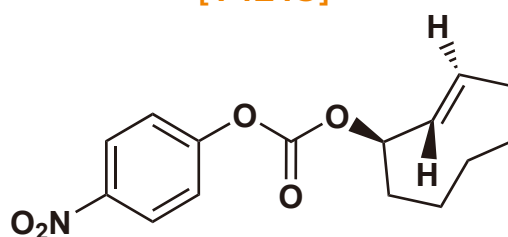
[T4213]



**TCO\*-NPC Axial Isomer**

100mg 24,000円

[T4218]



**TCO\*-NPC Equatorial Isomer**

100mg 26,000円

[T4219]

テトラジン類との反応速度は、TCO > TCO\*、axial > equatorialと報告されています。一方で、チオールが存在する生体内における安定性はTCO\* > TCOとされています<sup>5)</sup>。

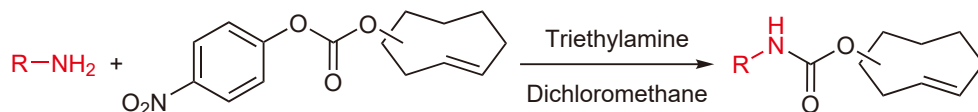
## 特長

- NPC部位がアミン類と温和な条件下で反応して、TCO誘導体を生成
- TCO部位にてテトラジン類と金属触媒不要の高速クリック反応が進行
- タンパク質標識やイメージング等に利用可能
- 特徴的なクリック&リリース反応を利用し、プロドラッグの研究にも応用可能
- 反応性および安定性の異なる4つの異性体をラインナップ

# テトラジン類と選択的に反応するコンジュゲーション試薬

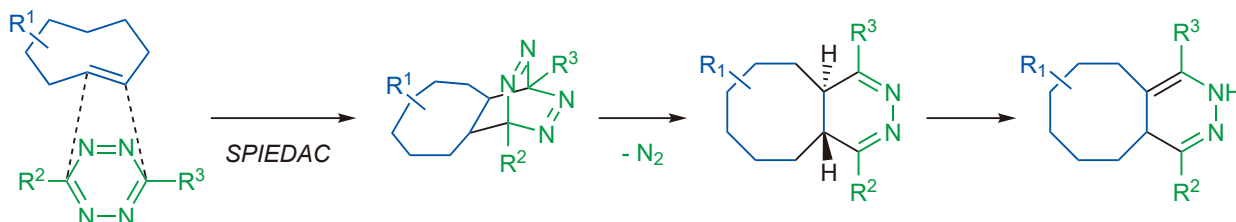
## 利用例

### アミン類との反応<sup>2)</sup>



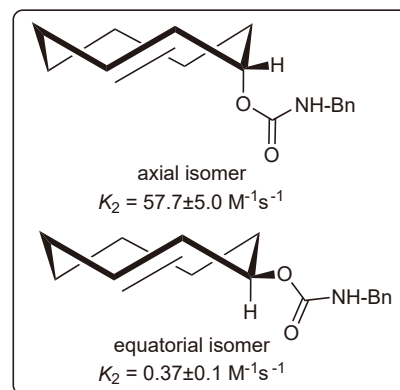
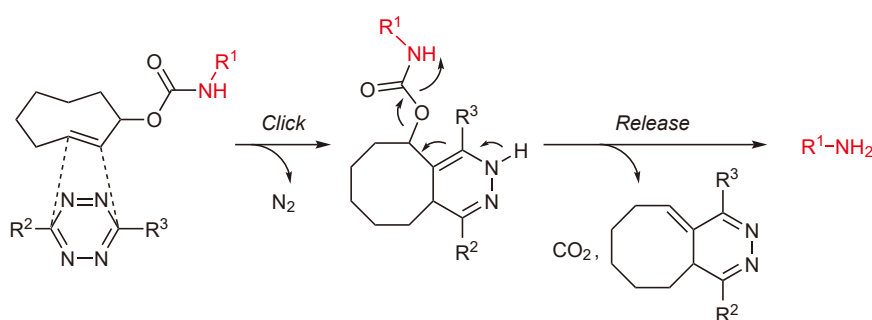
塩基性条件下、4-ニトロフェニルカルボナート (NPC) 部位はアミン類と容易に反応します。

### 歪み促進逆電子要請型Diels-Alder反応 (SPIEDAC)



TCOとテトラジン類は、金属触媒を必要とせず、選択的に高速で反応します。

### プロドラッグへの応用



近年、TCO\*とテトラジン類が“click-to-release”反応を示すことが報告されています<sup>6,7,8,9)</sup>。

- 引用文献
- 1) *J. Am. Chem. Soc.* **2008**, *130*, 13518. <https://doi.org/10.1021/ja8053805>
  - 2) *Angew. Chem. Int. Ed.* **2009**, *48*, 7013. <https://doi.org/10.1002/anie.200903233>
  - 3) *Angew. Chem. Int. Ed.* **2010**, *49*, 2869. <https://doi.org/10.1002/anie.200906120>
  - 4) *Chem. Soc. Rev.* **2017**, *46*, 4895. <https://doi.org/10.1039/C7CS00184C>
  - 5) *Angew. Chem. Int. Ed.* **2014**, *53*, 2245. <https://doi.org/10.1002/anie.201309847>
  - 6) *Angew. Chem. Int. Ed.* **2013**, *52*, 14112. <https://doi.org/10.1002/anie.201305969>
  - 7) *Chem. Commun.* **2016**, *52*, 6174. <https://doi.org/10.1039/C6CC01024E>
  - 8) *ACS Cent. Sci.* **2016**, *2*, 476. <https://doi.org/10.1021/acscentsci.6b00150>
  - 9) *Angew. Chem. Int. Ed.* **2016**, *55*, 14046. <https://doi.org/10.1002/anie.201608009>

### 関連製品

TCO-PEG3-Maleimide

TCO-PEG4-NHS

N-(4E)-TCO-L-lysine

5mg 11,800円 / 25mg 41,000円 [T3948]

5mg 11,800円 / 25mg 41,000円 [T3949]

25mg 33,000円 [T4126]

## 東京化成工業株式会社

### 試薬製品について

■本社営業部 〒103-0001 東京都中央区日本橋小伝馬町 16-12 T-PLUS 日本橋小伝馬町8階  
Tel: 03-3668-0489 Fax: 03-3668-0520 E-mail: Sales-JP@TCIchemicals.com

■大阪営業部 〒541-0041 大阪府大阪市中央区北浜1-1-21 第2中井ビル1階  
Tel: 06-6228-1155 Fax: 06-6228-1158 E-mail: osaka-s@TCIchemicals.com

### スケールアップ、受託サービス(合成・開発・製造)について

□化成品営業部 〒103-0001 東京都中央区日本橋小伝馬町 16-12 T-PLUS 日本橋小伝馬町8階  
Tel: 03-5651-5171 Fax: 03-5640-8021 E-mail: finechemicals@TCIchemicals.com

### 弊社製品取扱店

本誌掲載の化学品は試験・研究用のみ使用するものです。化学知識のある専門家以外の方のご使用はお避けください。品目や製品情報等、掲載内容の変更を予告なく行う場合があります。内容の一部または全部の無断転載・複製はご遠慮ください。