

SPAAC

<https://bioconjugation.bocsci.com/resources/strain-promoted-alkyne-azide-cycloadditions-spaac.html>

Cycloadditions d'alcyne-azoture promues par souche (SPAAC)

En tant que l'une des réactions de clic les plus courantes, la cycloaddition d'alcyne-azoture favorisée par la souche (SPAAC) ne nécessite pas l'utilisation de catalyseurs métalliques, d'agents réducteurs ou de ligands stables. Au contraire, la réaction utilise l'enthalpie libérée par la contrainte cyclique au cyclooctyne pour former du triazole stable. Introduction. SPAAC peut être réalisé efficacement. D'une part, l'énergie potentielle chimique des substrats d'azoture et d'alcyne en tant que réactifs est très élevée. Lorsque la réaction de cycloaddition génère du triazole stable, elle peut libérer plus de 188 kJ/mol de chaleur, ce qui satisfait à la condition que les réactifs nécessitent une énergie élevée. D'autre part, les azotures et les alcynes sont difficiles à réagir avec les biomolécules dans des conditions de réaction, et ils sont inertes à la plupart des autres réactifs et solvants réactionnels. En outre, les groupes alcynyle et azoture ont de petits poids moléculaires et des polarités faibles, qui ont peu d'influence sur les propriétés chimiques des structures connectées, et répondent à la sélectivité requise dans de nombreuses applications telles que la biologie et les matériaux. Par conséquent, SPAAC tire parti de la tension annulaire élevée de l'alcyne cyclique lui-même, et la réaction de clic avec régiosélectivité chimique peut se produire sans la participation d'un catalyseur en cuivre. Il s'agit d'une nouvelle réaction de cycloaddition d'alcyne azoturale efficace.

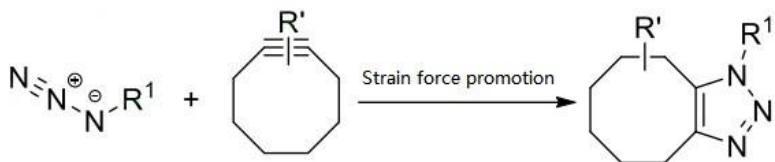


Fig.1 Mécanisme de réaction du SPAAC

SPAAC peut être appliquée aux systèmes biologiques en tant que réaction bio-orthogonale très efficace. Cette réaction a une bonne activité et sélectivité dans des conditions biologiques et maintient une bonne inertie à l'acidification, aux conditions d'oxydation et aux molécules actives d'acides aminés. Cependant, ce type de réaction nécessite une structure stricte de monomère et est difficile à préparer.

Application. En raison des avantages des conditions douces, de la simplicité et de l'efficacité élevée et de l'orthogonalité biologique, SPAAC a été largement utilisé dans de nombreux domaines tels que la biomédecine et les matériaux chimiques, montrant de fortes perspectives d'application.

• **Domaine pharmaceutique.** SPAAC a une bonne régio-sélectivité. Outre le fait qu'aucune impureté ne sera introduite au cours du processus de liaison directionnelle, l'introduction d'azotures et de cycloalcynes de faible poids moléculaire dans les macromolécules n'affectera pas l'expression de l'énergie effective des macromolécules après liaison. De plus, SPAAC a l'avantage de pouvoir survenir spontanément dans des conditions physiologiques. Par conséquent, SPAAC peut jouer un rôle dans l'orientation de la liaison spécifique dans le domaine de la médecine et est devenu un outil important dans le domaine de la médecine. En plus des médicaments anticancéreux synthétiques ciblés les plus importants et jouant un rôle traceur dans la recherche pathologique, SPAAC peut également être utilisé pour la synthèse et l'administration de médicaments conventionnels, et même aider à préparer des produits radio-pharmaceutiques hautement actifs.

• **Application en sciences de la vie.** SPAAC a une bonne bio-orthogonalité dans le domaine des biomolécules. En partant du principe que le catalyseur de cuivre n'est pas nécessaire, l'introduction d'azotures et de cycloalcynes seuls n'apportera pas de toxicité biologique ni n'affectera l'efficacité des biomolécules, de sorte qu'elle peut aider à réaliser de nombreuses synthèses ou liaisons spécifiques qui étaient difficiles à réaliser auparavant. Sa bonne réactivité orthogonale biologique lui permet de réagir dans les cellules ou tissus vivants sans interférer avec la réaction des processus biochimiques biologiques. Par exemple, une série d'hydrogels avec des propriétés de viscoélasticité, de rigidité et de dégradation contrôlables peut être construite avec précision grâce à SPAAC.

• **Application en science des matériaux.** Les caractéristiques de haute efficacité et de sélectivité de SPAAC ont également de bonnes perspectives d'application dans le domaine de la science des matériaux. Cette excellente propriété peut être utilisée pour la préparation de films, de revêtements, d'adhésifs, de polymères fonctionnels et de dendrimères, ou pour la modification de surface et la modification de matériaux. Par exemple, SPAAC entre les nanoclusters d'or fonctionnalisés azoturés et la cyclooctyne a ouvert une nouvelle plate-forme pour la modification de surface des nanoclusters après assemblage fonctionnel.