

富士フイルム 和光純薬株式会社

# 有機合成用

# 縮合剤

第2版

カルボジイミド系

p.3

イミダゾール系

p.5

トリアジン系

p.6

ホスホニウム系

p.8

ウロニウム系

p.10

ハロウロニウム系

p.12

添加剤

p.13

担持縮合剤 SiliCycle社 製品

p.14

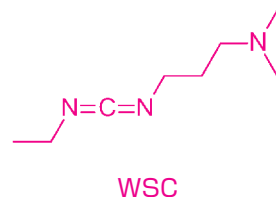
## 略語一覧

Bn	ベンジル
Boc	<i>tert</i> -ブトキシカルボニル
Cbz	ベンジルオキシカルボニル
Gly	グリシン
Leu	ロイシン
Phe	フェニルアラニン
PMB	<i>p</i> -メトキシベンジル
TBS	<i>tert</i> -ブチルジメチルシリル
Tf	トリフルオロメチルスルホニル
Val	バリン

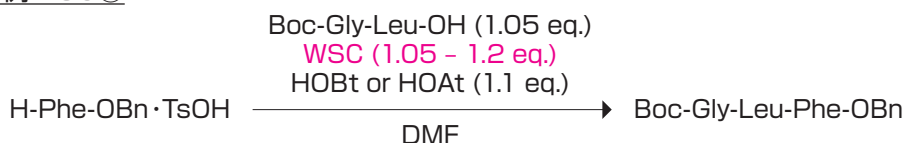
# カルボジイミド系縮合剤

## 特 長

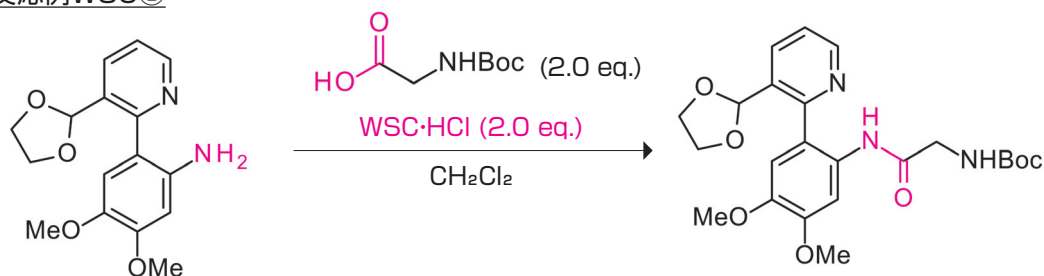
- 縮合反応で汎用的に用いられています。
- エステル化、アミド化、ペプチドの合成に適しています。
- WSCおよびWSC・HClは反応後の精製が容易です。
- アミノ酸の縮合などラセミ化が進行する反応の際は、添加剤としてHOBtやHOAt (p.13)を触媒量から当量加えて反応を行います。<sup>[a]</sup>



## ◆反応例WSC①<sup>[b]</sup>



## ◆反応例WSC②<sup>[c]</sup>



## 反応

carboxylic acid (S.M.)  
 amine (S.M.)  
 WSC·HCl  
 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>  
 rt, 10 min

## 精製

CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>

extraction

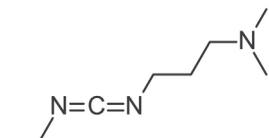
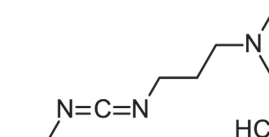
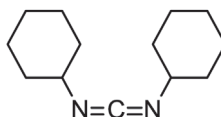

water

wash

column

Yield: 76%

# カルボジイミド系縮合剤

品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド	WSC (EDC)	322-73521 320-73522	5g 25g	5,900 20,100
	FW.155.24	規格	特記事項	
		—	WSC由来の副生物が水に容易に溶解するため、反応後の抽出で除去することができる。	
		CAS No.		
		1892-57-5		
		法規/保管		
		☑ / ☐		
塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド	WSC-HCl (EDC-HCl)	348-03631	5g	6,400
		346-03632	25g	22,000
		344-03633	100g	65,600
	FW.191.70	規格	特記事項	
		ペプチド合成用	WSCの塩酸塩。WSCと同様に使用でき、反応性もほとんど変わらないといわれている。副生物は抽出操作で除去できる。 <sup>[d]</sup>	
		CAS No.		
		25952-53-8		
		法規/保管		
		— / —		
N,N'-ジシクロロヘキシルカルボジイミド	DCC	040-01682	25g	1,850
		042-01681	100g	3,900
		044-01685	500g	11,800
	FW. 206.33	規格	特記事項	
		和光一級	カルボジイミド系の縮合剤でもっとも多く使われている。アミド化以外にもエステル、酸無水物の合成も可能。副生物の尿素が分離の課題になることもあるが、ろ過での除去も可能。 <sup>[e]</sup>	
		CAS No.		
		538-75-0		
		法規/保管		
		— / ☑		
N,N'-ジイソプロピルカルボジイミド	DIC	042-32892	25g	6,000
		044-32891	100g	13,000
		046-32895	500g	50,000
	FW.126.20	規格	特記事項	
		有機合成用	DCCと同様に汎用的に使用される。副生物の尿素はシクロロメタンに溶解するため、生成物の溶解性によってはシクロロメタンの洗浄で分離が可能。	
		CAS No.		
		693-13-0		
		法規/保管		
		☑ / —		

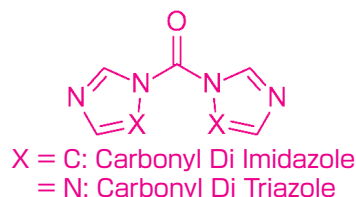
## 〈参考文献〉

- [a] Montalbetti, C. A. G. N. and Falque, V. : *Tetrahedron*, **61**, 10827 (2005).  
 Valeur, E. and Bradley, M. : *Chem. Soc. Rev.*, **38**, 606 (2009).  
 [b] Carpino, L. A., Xia, J. and El-Faham, A. : *J. Org. Chem.*, **69**, 54 (2004).  
 [c] Li, J-L., Zhao, H-W., Qin, X., Cui, J., Su, S., Li, H-L., Yue, Y-Y. and Song, X-Q. : *Synth. Commun.*, **43**, 3175 (2013).  
 [d] Sheehan, J. C., Cruickshank, P. A. and Boshart, G. L. : *J. Org. Chem.*, **26**, 2525 (1961).  
 [e] Revelou, P., Kokotos, C. G. and Moutevelis-Minakakis, P. : *Tetrahedron*, **68**, 8732 (2012).

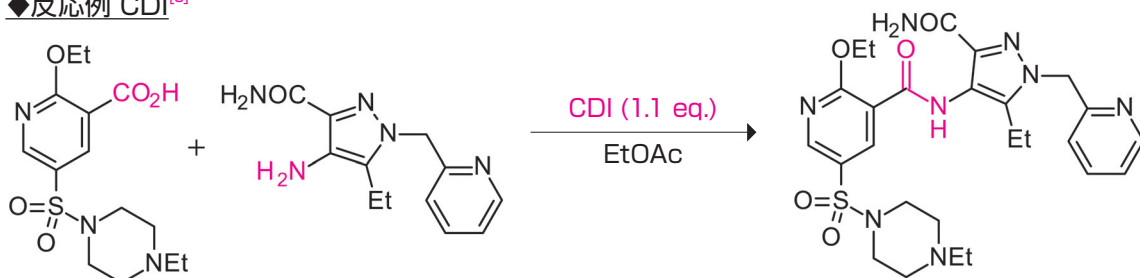
# イミダゾール系縮合剤

## 特 長

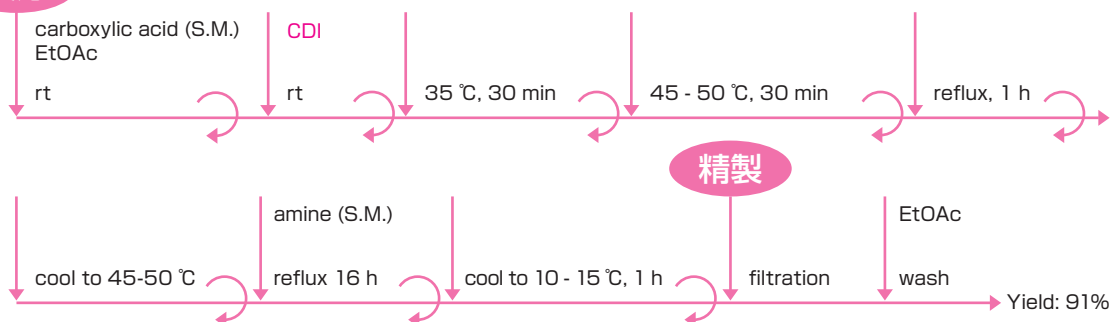
- エステル化、アミド化、ペプチド、チオエステルの合成に適しています。<sup>[a]</sup>
- 一般的に、加熱条件下では副反応が懸念され推奨されません。
- DMF中の低温反応がラセミ化を抑制できるとの報告もあります。<sup>[b]</sup>



## ◆反応例 CDI<sup>[c]</sup>



## 反応



## 精製

品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
N,N'-カルボニルジイミダゾール	CDI	039-22612	25g	7,000
		031-22611	250g	36,000
 FW. 162.15		規格	特記事項	
		有機合成用	ペプチド合成でのkgスケール単位の合成実績も報告されている。また反応時は基質と当量の炭酸ガスが発生するので注意が必要。	
		CAS No.		
		530-62-1		
		法規/保管		
1,1'-カルボニルジ(1,2,4-トリアゾール)	CDT	035-23731	5g	9,500
		033-23732	25g	33,000
		規格	特記事項	
		有機合成用	反応時は基質と当量の炭酸ガスが発生するので注意が必要。	
		CAS No.		
		41864-22-6		
		法規/保管		
 FW. 164.12		—/Re <sup>o</sup>		

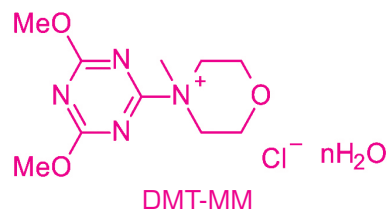
## 〈参考文献〉

- [a] Montalbetti, C. A. G. N. and Falque, V. : *Tetrahedron*, **61**, 10827 (2005).  
Valeur, E. and Bradley, M. : *Chem. Soc. Rev.*, **38**, 606 (2009).  
[b] Paul, R. and Anderson, G. W. : *J. Am. Chem. Soc.*, **82**, 4596 (1960).  
[c] Dale, D. J., Draper, J., Dunn, P. J., Hughes, M. L., Hussain, F., Levett, P. C., Ward, G. B. and Wood, A. S. : *Org. Process Res. Dev.*, **6**, 767 (2002).

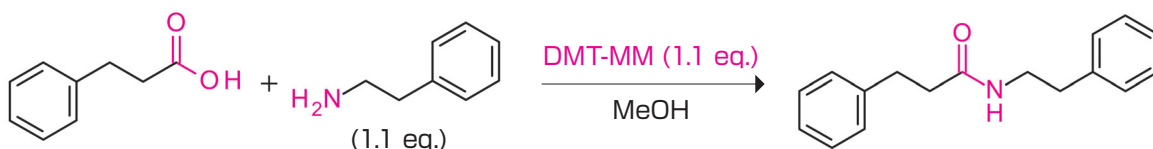
# トリアジン系縮合剤

## 特 長

- エステル化、アミド化、ペプチドの合成に適しています。
- アミド化の際は反応溶媒に水やメタノールなどの低分子アルコールを用いることができます。
- DMT-MMを用いた反応は塩基を加える必要がありません。
- 副生成物は水溶性なので水の洗浄で容易に除去できます。<sup>[a]</sup>



## ◆反応例<sup>[b]</sup>



## 反応

carboxylic acid (S.M.)  
amine (S.M.)  
MeOH

rt

DMT-MM

rt, 3 h

## 精製

Et<sub>2</sub>O  
sat. Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> aq.

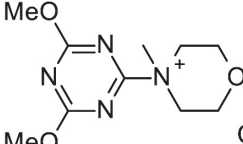
extraction

1N HCl  
H<sub>2</sub>O

wash

preparative TLC

Yield: 98%

品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
4-(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イル)-4-メチルモルホリニウムクロリドn水和物	DMT-MM	047-32401	5g	7,500
		045-32402	25g	21,500
		043-32403	100g	63,000
<div></div> <div>Cl<sup>-</sup> nH<sub>2</sub>O FW. 276.72(Anhydrous)</div>		規格	特記事項	
		有機合成用	アミド合成の溶媒に水やメタノールを使用でき、アミド化が選択的に進行する。室温・中性条件で反応が進行し、混合溶液中でも反応が進行する。 <sup>[c]</sup>	
		CAS No.		
		3945-69-5		
		法規/保管		
		—/Ref <sup>2</sup>		

※DMT-MMは、バルク数量での対応も可能です。(Code:321-53750)

〈参考文献〉

[a] Kunishima, M., Kawachi, C., Morita, J., Terao, K., Iwasaki, F. and Tani, S. : *Tetrahedron*, **55**, 13159 (1999).

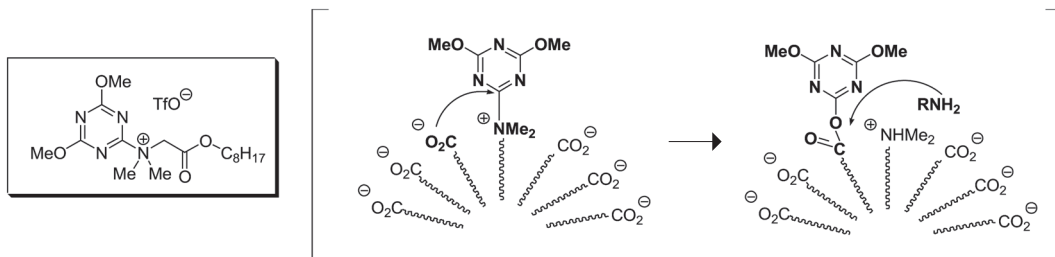
[b] Kunishima, M., Kawachi, C., Hioki, K., Terao, K. and Tani, S. : *Tetrahedron*, **57**, 1551 (2001).

[c] 国嶋崇隆:和光純薬時報, **72** (2) 8, (2004).

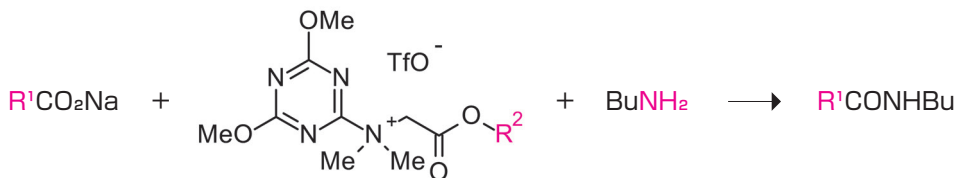
DMT-MMが水を含む溶媒中で使用可能な縮合剤として報告されていましたが、その特性上、水に不溶な基質には適さない場合があります。界面集積型DMT-MMIは、DMT-MMIに疎水性基を導入することで、疎水性基をもつ基質を水界面へ集積させ、反応を行うことができる、高効率の縮合剤です。<sup>[d] [e]</sup>



## ●ミセル界面において反応が加速する模式図



## ●基質のアルキル鎖長と反応速度の相関



1A:  $R^1 = C_3H_7$

1B:  $R^1 = C_7H_{15}$

1C:  $R^1 = C_{11}H_{23}$

1D:  $R^1 = C_8H_{17}CH=CHC_7H_{15}$

2a:  $R^2 = C_2H_5$

2b:  $R^2 = C_8H_{17}$  (本品)

3A-D

1A-2aの擬1次反応速度定数を1とした時の各基質における相対的反応速度

	1A	1B	1C	1D	time(min)	0.5	0.75	1
2a	1*	1.1	56	63	yield(%)	41.4	64.8	74.5
2b(本品)	0.7	3	1200	830				

\* 擬1次反応速度定数  
 $k = 1.0 \times 10^{-3} \text{ (min}^{-1}\text{)}$

品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
トリフルオロメタンスルホン酸(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イル)-(2-オクトキシ-2-オキシエチル)ジメチルアンモニウム	界面集積型 DMT-MM	040-32751	1g	17,000
		046-32753	5g	65,000
		規格	特記事項	
		有機合成用	本製品は両親媒性構造である。本製品と脂肪酸塩類の基質を使用すると、反応系中でミセルを形成し、ミセル界面に反応点が集積し反応速度が加速する。 <sup>[d]</sup>	
		CAS No.		
		法規/保管		
		—/Re <sup>2</sup>		

〈参考文献〉

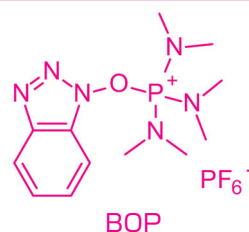
[d] Dwars, T., Paetzold, E. and Oehme, G.: *Angew. Chem. Int. Ed.*, **44**, 7254 (2005).

[e] 国嶋崇隆:和光純薬時報, **81** (1) 2, (2013).

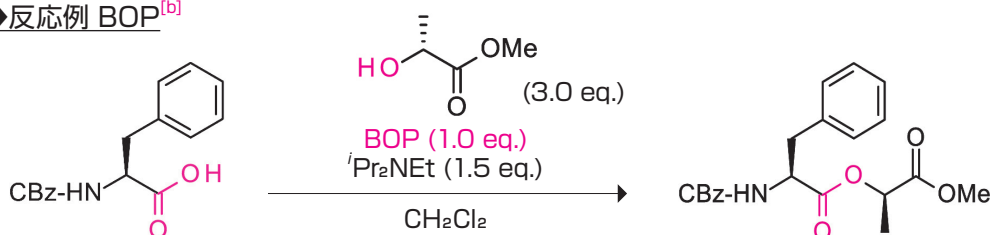
# ホスホニウム系縮合剤

## 特 長

- アミド、ペプチドの合成で汎用的に用いられています。
- HOBt、HOAt骨格を有するものはラセミ化抑制作用の高いものが多くあります。
- 反応は速やかに進行し精製が容易です。<sup>[a] [b]</sup>
- 固相合成に適する非常に活性の高い縮合剤です。



## ◆反応例 BOP<sup>[b]</sup>



## 反応

amino acid (S.M.)  
iPr<sub>2</sub>NEt  
CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>  
-20 °C

alcohol (S.M.)

-20 °C, 15 min

BOP

rt, overnight

## 精製

pH=4 buffer  
sat. NaCl aq.  
sat. NaHCO<sub>3</sub> aq.

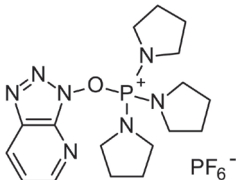
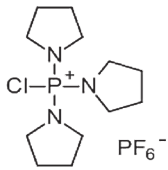
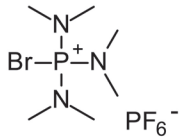
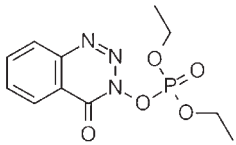
wash

column

Yield: 84%

品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
1H-ベンゾトリアゾール-1-イルオキシトリシ(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロりん酸塩	BOP	021-17742	25g	8,000
		023-17741	100g	25,000
<p>FW.442.28</p>		規格	特記事項	
		有機合成用	HOBtを基に開発された縮合剤であり、ラセミ化を抑制する。反応の副生物であるHMPA(ヘキサメチルりん酸トリアミド)は毒性が高いため、毒性の低いPyBOPも後に開発された。 <sup>[c] [d]</sup>	
		CAS No.		
		56602-33-6		
		法規/保管	—/Re <sup>2</sup>	
1H-ベンゾトリアゾール-1-イルオキシトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロりん酸塩	PyBOP	026-17731	5g	7,000
		024-17732	25g	23,500
<p>FW.520.39</p>		規格	特記事項	
		有機合成用	BOP試薬の毒性を考慮し改良された製品で、反応性・ラセミ化抑制能も同等以上に発揮する。 <sup>[d]</sup>	
		CAS No.		
		128625-52-5		
		法規/保管	—/Re <sup>2</sup>	



品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
(7-アザベンゾトリアゾール-1-イルオキシ) トリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロりん酸塩	PyAOP	019-25591	1g	5,000
		015-25593	5g	13,000
		017-25592	25g	50,000
 FW.521.38	規格	特記事項		
	有機合成用	HOAtを基に開発されたホスホニウム縮合剤。かさ高いアミノ酸や環状ペプチドの固相合成に利用されている。 <sup>[e]</sup>		
	CAS No.			
	156311-83-0			
	法規/保管			
—/E°				
クロロトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロりん酸塩	PyClOP	038-22621	1g	5,000
		034-22623	5g	10,000
		036-22622	25g	35,000
 FW.421.73	規格	特記事項		
	有機合成用	HOBt部分がClに置換された反応性の高いホスホニウム系縮合剤である。 <sup>[f]</sup>		
	CAS No.			
	133894-48-1			
	法規/保管			
—/Ref°				
プロモトリス(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロりん酸塩	Brop	021-18641	5g	14,000
		029-18642	25g	55,000
 FW.388.07	規格	特記事項		
	有機合成用	N-メチル化されたアミノ酸の縮合反応に効果的。反応時間も短時間で進行する。エビメリ化せずにジペプチドを合成した報告もある。 <sup>[g]</sup>		
	CAS No.			
	50296-37-2			
	法規/保管			
—/—				
3-(ジエトキシホスホリルオキシ)-1,2,3-ベンゾトリアジン-4(3H)-オン	DEPBT	044-32911	5g	8,500
		042-32912	25g	28,000
 FW.299.22	規格	特記事項		
	有機合成用	鎖状ペプチドや環状ペプチドの合成に用いられる。アミノ基側の基質においてヒドロキシル基を保護せずに反応できる報告もある。 <sup>[h]</sup>		
	CAS No.			
	165534-43-0			
	法規/保管			
—/—				

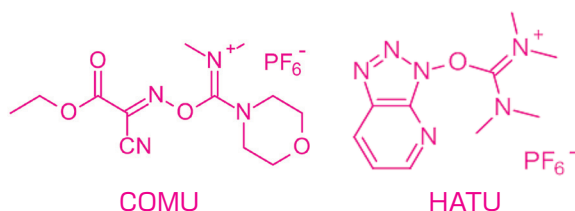
〈参考文献〉

- [a] Montalbetti, C. A. G. N. and Falque, V. : *Tetrahedron*, **61**, 10827 (2005).  
Valeur, E. and Bradley, M. : *Chem. Soc. Rev.*, **38**, 606 (2009).  
[b] Kim, M. H. and Patel, D. V. : *Tetrahedron Lett.*, **35**, 5603 (1994).  
[c] Castro, B., Dormoy, J. R., Evin, G. and Selve, C. : *Tetrahedron Lett.*, **14**, 1219 (1975).  
[d] Coste, J., Le-Nguyen, D. and Castro, B. : *Tetrahedron Lett.*, **31**, 205 (1990).  
[e] Albericio, F., Cases, M., Alsina, J., Triolo, S. A., Carpino, L. A. and Kates, S. A. : *Tetrahedron Lett.*, **38**, 4853 (1997).  
[f] Coste, J., Frérot, E. and Jouin, P. : *Tetrahedron Lett.*, **32**, 1967 (1991).  
[g] Coste, J., Dufour, M.-N., Pantaloni, A. and Castro, B. : *Tetrahedron Lett.*, **31**, 669 (1990).  
[h] Ye, Y.-H., Li, H. and Jiang, X. : *Biopolymers (Pept. Sci.)*, **80**, 172 (2005).

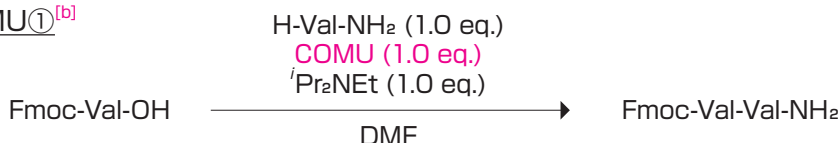
# ウロニウム系縮合剤

## 特長

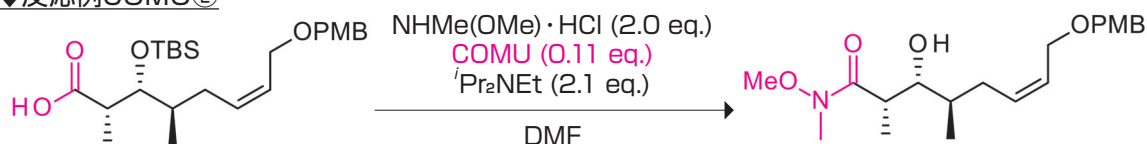
- アミド、ペプチドの合成で汎用的に用いられています。
- HATU、HBTUを始め、ラセミ化の抑制能の優れているものが多くあります。<sup>[a]</sup>
- COMUは色により反応追跡ができます。<sup>[b]</sup>



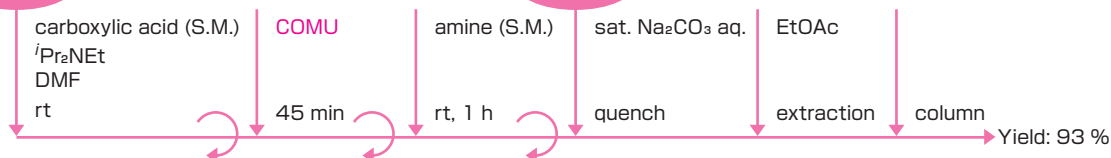
### ◆反応例COMU①<sup>[b]</sup>



### ◆反応例COMU②<sup>[c]</sup>

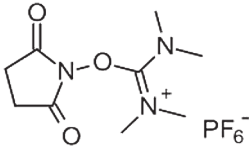
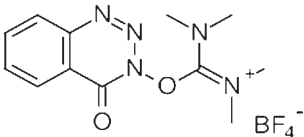
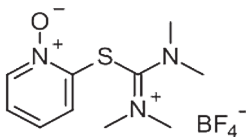
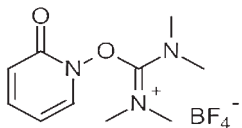
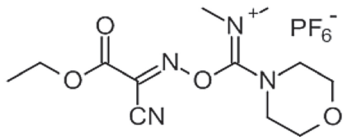


## 反応



## 精製

品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
O-(ベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロりん酸塩	HBTU	022-14891	5g	4,000
		020-14892	25g	14,000
		025-18781	100g	34,000
		027-18785	500g	95,000
		規格	特記事項	
		ペプチド合成用 有機合成用	ラセミ化を抑制する縮合剤。HOBTを構造に有しており、添加剤であるHOBTを加えずにラセミ化の抑制が可能である。 <sup>[d]</sup>	
		CAS No.		
		94790-37-1		
		法規/保管	特記事項	
		—/Ref <sup>2</sup>		
		有機合成用		
		CAS No.	HATUはHBTUと同様、ラセミ化を抑制する縮合剤。HOAtを構造に組み込んでいるため、添加剤無しでラセミ化を抑制する。 <sup>[d]</sup> <sup>[e]</sup>	
O-(7-アザベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロりん酸塩	HATU	018-26122	25g	23,000
		010-26121	100g	65,000
		012-26125	500g	照 会
		法規/保管	特記事項	
		190-16601	1g	5,000
		196-16603	5g	10,000
		198-16602	25g	30,000
		規格	特記事項	
O-(N-スクシンイミジル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロほう酸塩	TSTU	有機合成用	スクシンイミド基が良い脱離基として作用し、反応の促進が可能。水存在下で反応が進行する。HOBTを添加剤として使うことでラセミ化を抑制可能。 <sup>[f]</sup>	
		CAS No.		
		105832-38-0		
		法規/保管	特記事項	
		—/Ref <sup>2</sup>	特記事項	
		—/Ref <sup>2</sup>		
		—/Ref <sup>2</sup>		
		法規/保管	特記事項	

品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
O-(N-スクシンイミジル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロりん酸塩	HSTU	195-17712	25g	19,000
 FW.359.21		規格	特記事項	
		有機合成用	TSTUの塩違い。反応性もほぼ同等。	
		CAS No.		
		265651-18-1		
		法規/保管	—/E°	
O-(3,4-ジヒドロ-4-オキソ-1,2,3-ベンゾトリアジン-3-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロほう酸塩	TDBTU	041-32541 047-32543	1g 5g	6,000 18,000
 FW.349.09		規格	特記事項	
		有機合成用	ラセミ化の抑制能が高い。エビメリ化が起こりやすいアミノ酸(Bz-Pheを用いた例)では添加剤無しで高いラセミ化抑制を達成している。 <sup>[f]</sup>	
		CAS No.		
		125700-69-8		
		法規/保管	Ⅲ-II / E°	
S-(1-オキシド-2-ピリジル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロほう酸塩	TOTT	156-03291 152-03293 154-03292	1g 5g 25g	6,500 17,000 67,000
 FW.313.12		規格	特記事項	
		有機合成用	通常困難であるα,α-ジアルキルアミノ酸(α-Aminoisobutyric Acid)を用いたカップリング反応において良好な反応性を示す。 <sup>[g]</sup>	
		CAS No.		
		255825-38-8		
		法規/保管	Ⅲ-II / E°	
O-[2-オキソ-1(2H)-ピリジル]-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロほう酸塩	TPTU	155-03261 153-03262	5g 25g	10,000 35,000
 FW.297.06		規格	特記事項	
		有機合成用	添加剤無しで高いラセミ化抑制能を有するが、HOBtを加えることで更に高い抑制能を期待できる。 <sup>[a][f]</sup>	
		CAS No.		
		125700-71-2		
		法規/保管	Ⅲ-II / E°	
{{[(1-シアノ-2-エトキシ-2-オキソエチリデン)アミノ]オキシ}-4-モルホリノメチレン}ジメチルアンモニウムヘキサフルオロりん酸塩	COMU	038-22481 036-22482 034-22483	5g 25g 100g	8,000 24,000 78,000
 FW.428.27		規格	特記事項	
		有機合成用	反応性はHATUと同等以上の性能を有しており、色による反応追跡ができる。爆発性がHOBtに比べ低い扱いやすい。 <sup>[b]</sup>	
		CAS No.		
		1075198-30-9		
		法規/保管	Ⅲ-II / E°	

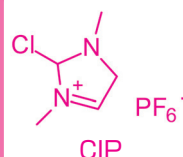
〈参考文献〉

- [a] Montalbetti, C. A. G. N. and Falque, V. : *Tetrahedron*, **61**, 10827 (2005).  
Valeur, E. and Bradley, M. : *Chem. Soc. Rev.*, **38**, 606 (2009).  
[b] El-Faham, A., Funosas, R. S., Prohens, R. and Albericio, F. : *Chem. Eur. J.*, **15**, 9404 (2009).  
[c] Kusuma, B. R., Brandt, G. E. and Blagg, B. S. J. : *Org. Lett.*, **14**, 6242 (2012).  
[d] Carpino, L. A., El-Faham, A. and Albericio, F. : *Tetrahedron Lett.*, **35**, 2279 (1994).  
[e] Carpino, L. A. and El-Faham, A. : *J. Org. Chem.*, **59**, 695 (1994).  
[f] Knorr, R., Trzeciak, A., Bannwarth, W. and Gillesen, D. : *Tetrahedron Lett.*, **30**, 1927 (1989).  
[g] Bailén, M. A., Chinchilla, R., Dodsworth, D. J. and Nájera, C. : *J. Org. Chem.*, **64**, 8936 (1999).

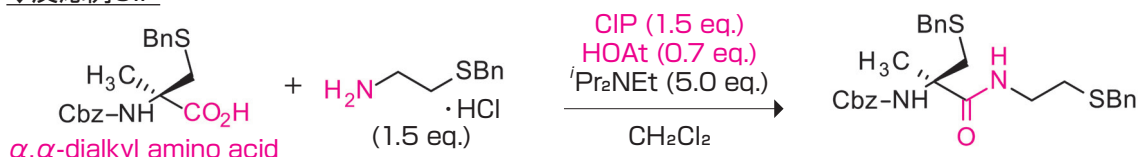
# ハロウロニウム系縮合剤

## 特 長

- アミド、ペプチドの合成で使用可能です。特に立体的に込み合ったN-置換アミノ酸、 $\alpha,\alpha$ -ジアルキルアミノ酸など、通常では難しい条件のアミノ酸に対して良好な反応性を示します。<sup>[a]</sup>
- ラセミ化を抑制させるため、添加剤を併せて使用する場合もあります。

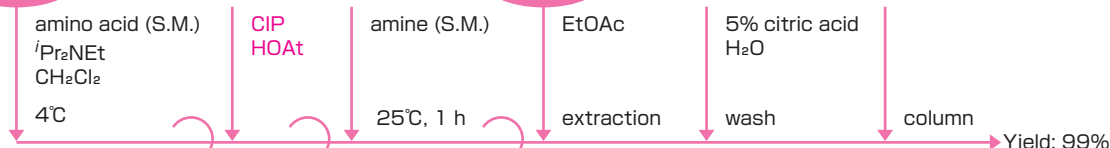


## ◆反応例CIP<sup>[a]</sup>



## 反応

## 精製



品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム ヘキサフルオロりん酸塩	CIP	036-23641	5g	10,000
		034-23642	25g	35,000
<p>FW.278.56</p>		規格	特記事項	
		有機合成用	CIPはHOAtを添加剤として使用することで $\alpha,\alpha$ -ジアルキル化された反応性の低いアミノ酸のカップリングも進行する。 <sup>[a]</sup>	
		CAS No.		
		101385-69-7		
		法規/保管	—/室温	
1-(クロロ-1-ピロリジニルメチレン)ピロリジニウム ヘキサフルオロりん酸塩	PyCIU	034-23681	5g	13,000
		032-23682	25g	45,000
<p>FW.332.65</p>		規格	特記事項	
		有機合成用	反応性の低いN-メチル化されたアミノ酸のカップリングにおいても良好な反応性を示す。 <sup>[b]</sup> 安定で使いやすい縮合剤。	
		CAS No.		
		135540-11-3		
		法規/保管	—/Ref <sup>2</sup>	
2-フルオロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム ヘキサフルオロりん酸塩	DFIH	060-06341	1g	5,500
		066-06343	5g	15,000
		068-06342	25g	55,000
<p>FW.262.11</p>		規格	特記事項	
		有機合成用	安定で吸湿性が少ない縮合剤。反応系内でフッ素化試薬として作用し、カルボン酸から酸フッ化物を生成する。本反応は、FmocやCbzなどの保護基の他に、tert-ブチルエステルや、酸に弱い保護基でも反応条件に耐えることができる。 <sup>[c]</sup>	
		CAS No.		
		164298-27-5		
		法規/保管	—/Ref <sup>2</sup>	
フルオロ-N,N,N',N'-テトラメチルホルムアミジニウム ヘキサフルオロりん酸塩	TFFH	066-06321	1g	6,500
		062-06323	5g	21,000
<p>FW.264.12</p>		規格	特記事項	
		有機合成用	安定で吸湿性が少ない縮合剤。反応系内でフッ素化試薬として作用し、カルボン酸から酸フッ化物を生成する。本反応は、FmocやCbzなどの保護基の他に、tert-ブチルエステルや、酸に弱い保護基でも反応条件に耐えることができる。 <sup>[c]</sup>	
		CAS No.		
		164298-23-1		
		法規/保管	—/Ref <sup>2</sup>	

〈参考文献〉

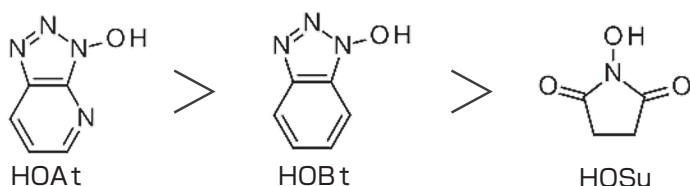
- [a] Akaji, K., Kuriyama, N. and Kiso, Y.: *J. Org. Chem.*, **61**, 3350 (1996).  
 [b] Coste, J., Frérot, E. and Jouin, P.: *Tetrahedron Lett.*, **32**, 1967 (1991).  
 [c] Carpino, L. A. and El-Faham, A.: *J. Am. Chem. Soc.*, **117**, 5401 (1995).

# 縮合反応 活性エステル 添加剤

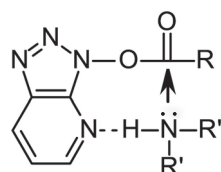
## 特 長

- 添加剤は一般的な縮合試薬に少量～当量添加することで反応時間・収率を向上させる目的や、アミノ酸/ペプチドカップリングで問題となるラセミ化を抑制する目的で用いられます。

### ラセミ化抑制能の比較<sup>[a]</sup>



### HOAtの近接効果



品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
1-ヒドロキシベンゾトリアゾール	HOBt	349-03622 341-03621	25g 100g	5,800 17,600
 FW.153.14		規格	特記事項	
		—	カルボジイミド系/ホスホニウム系/ウロニウム系の縮合反応で、HOBtを少量～当量添加することで、ペプチドのα位のラセミ化を抑制することができる。 <sup>[a]</sup>	
		CAS No.		
		2592-95-2		
		法規/保管	図/—	
1-ヒドロキシ-7-アザベンゾトリアゾール	HOAt	325-29161 321-29163	1g 5g	5,200 16,200
 FW.136.11		規格	特記事項	
		—	HOBt同様、ペプチドのα位のラセミ化を抑制するために添加する。また、HOBtよりも反応性が高く、ラセミ化の抑制作用も大きいと言われている。 <sup>[a]</sup>	
		CAS No.		
		39968-33-7		
		法規/保管	—/—	
N-ヒドロキシコハク酸イミド	HOSu	081-09771 083-09775	100g 500g	9,000 35,000
 FW.115.09		規格	特記事項	
		有機合成用	ラセミ化を抑制する添加剤として用いられる。HOBt, HOAtと比較してラセミ化抑制能は若干劣るが安価であることがメリット。	
		CAS No.		
		6066-82-6		
		法規/保管	—/Re <sup>2</sup>	
炭酸N,N'-ジスクシンイミジル	DSC	044-32531 040-32533 042-32532	1g 5g 25g	4,200 8,000 24,000
 FW.256.17		規格	特記事項	
		有機合成用	アミノ酸の縮合反応に用いられる。スクシンイミドの活性エステルを形成し、反応を促進する。	
		CAS No.		
		74124-79-1		
		法規/保管	—/Re <sup>2</sup>	

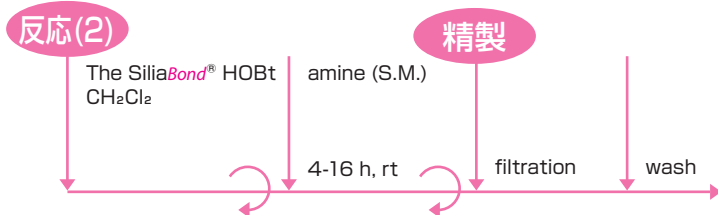
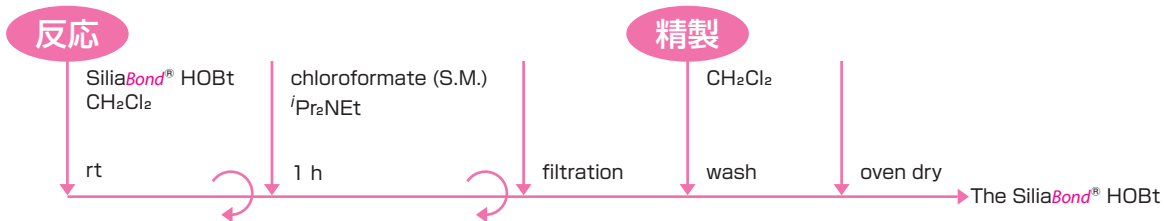
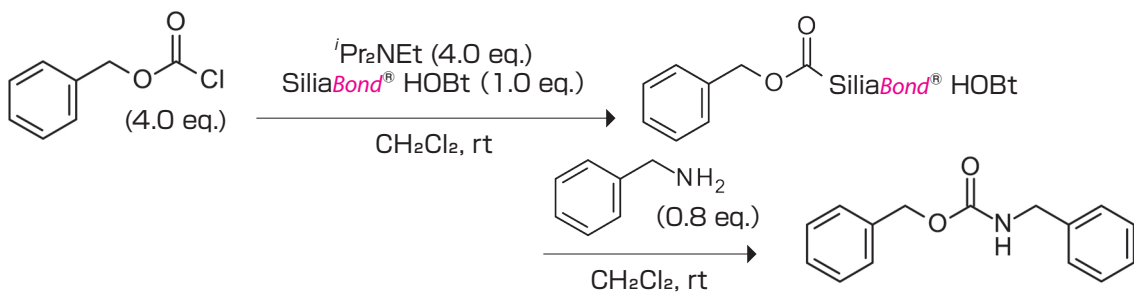
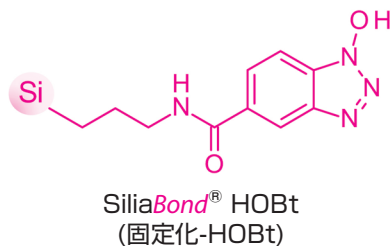
〈参考文献〉

- [a] 1) Knorr, R., Trzeciak, A., Bannwarth, W. and Gillissen, D.: *Tetrahedron Lett.*, **30**, 1927 (1989).  
 2) Carpino, L. A.: *J. Am. Chem. Soc.*, **115**, 4397 (1993).  
 3) Carpino, L. A., El-Faham, A. and Albericio, F.: *Tetrahedron Lett.*, **35**, 2279 (1994).

**担持縮合剤 SiliCycle社 製品**

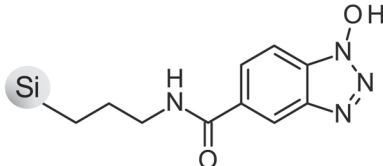

## 特 長

- SiliaBond<sup>®</sup> はシリカゲルに縮合剤を結合させたものです。
- 縮合剤がシリカゲルに結合しているため、回収・再利用が可能です。
- SiliaBond<sup>®</sup> HOBtは無水HOBtの爆発の危険性を低減することができます。

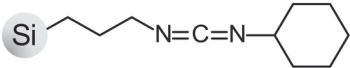
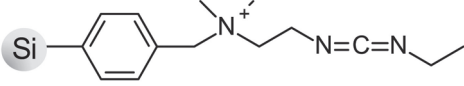
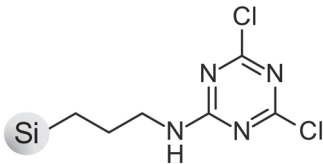


活性化と再利用結果	
Entry	Yield.
Activation	96%
1st recycling	86%
2nd recycling	95%
3rd recycling	96%

Conversion was determined by GC-MS

品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
SiliaBond® HOBt	Si-HOBt	510-91401	5g	25,800
		(R70730B)	10g	照 会
			25g	照 会
			50g	154,500
			100g	247,200
			250g	581,700
			500g	1,098,800
		Active Loading	特記事項	
		0.7 mmol/g	通常のHOBtと同様に使用できます。固定化することで精製を簡便化し、さらに爆発性を抑えています。使用溶媒は非プロトン性溶媒を推奨します。	
		CAS No.		
		-		
		法規/保管		
				

# SiliaBond® シリーズ

品名	略称	コード	容量	希望納入価格(円)
SiliaBond® Carbodiimide	Si-DCC	517-30611	5g	17,300
		R70530B	10g	26,900
			25g	53,800
			50g	100,900
			100g	161,400
			250g	379,800
			500g	717,400
			1kg	1,291,400
		Active Loading	特記事項	
		1.0 mmol/g	DCCの精製を容易にしたタイプです。通常のDCCと同様に使用できます。使用溶媒は非プロトン性溶媒を推奨します。	
		CAS No.		
		-		
		法規/保管		
SiliaBond® Ethyl Carbodiimide (EDC)	Si-EDC	R70630B	5g	19,500
			10g	31,200
			25g	62,300
			50g	116,900
			100g	187,000
			250g	440,000
			500g	831,100
		Active Loading	特記事項	
		0.8 mmol/g	WSC (EDC)の精製を容易にしたタイプです。通常のEDCと同様に使用できます。使用溶媒は非プロトン性溶媒を推奨します。	
		CAS No.		
		-		
		法規/保管		
		—/—		
SiliaBond® Dichlorotriazine (DCT)	Si-DCT	R52230B	5g	17,300
			10g	27,000
			25g	53,900
			50g	101,100
			100g	161,700
			250g	380,500
			500g	718,700
			1kg	1,293,600
		Active Loading	特記事項	
		0.7 mmol/g	シアヌル酸はアミドのカップリングに有用ですが毒性が強い事が難点です。固定化されたシアヌル酸は濾過で安全に除去できます。使用溶媒は非プロトン性溶媒を推奨します。	
		CAS No.		
		-		
		法規/保管		
		Ref		

## SiliCycle社カタログ

その他製品のご要望は、弊社営業担当または販売店までご連絡ください。

SiliCycle Inc. SiliaBond® (PDFカタログ 119P 17.9MB)



☞…2～10℃保存    ☞…-20℃保存    ☞…-80℃保存    表示が無い場合は室温保存です。

特定 ☞-I …特定毒物    ☞-I ☞-II …毒物    ☞-I ☞-II ☞-III …劇物    ☞…毒薬    ☞…劇薬    ☞…危険物    ☞…向精神薬    ☞…特定麻薬向精神薬原料

☞-I …化審法 第一種特定化学物質    ☞-2 …化審法 第二種特定化学物質    ☞兵1 …化学兵器禁止法 第一種指定物質    ☞兵2 …化学兵器禁止法 第二種指定物質    ☞カルタヘナ

覚せい剤取締法…「覚せい剤原料研究者又は取扱者」の免許を取得して、ご購入に際しては、譲受証及び譲渡証による受け渡しが必要となります。

国民保護法…生物・毒薬兵器の製造、使用防止のため、「毒薬等」を試験研究用に使用することを確認する証を頂戴しております。

ダイオキシン類…特に法的な規制はございませんが、取扱いに際し特に厳重を要するため、「ダイオキシン類」を試験研究用に使用することを確認する証を頂戴しております。

上記以外の法律及び最新情報は、試薬ホームページ(<https://labchem-wako-fujifilm.com>)をご参照ください。

本カタログは当社で販売している縮合材関連試薬を中心に掲載しております。  
この他にも当社では、有機合成関連製品を多数取扱っております。

ホームページを併せてご利用ください。

<https://labchem-wako.fujifilm.com>

※本カタログに記載されておりますのは上記主要な法規に関してのみであり、全ての法規の表示はしていません。  
該当法規の詳細については <https://labchem-wako.fujifilm.com> よりご確認ください。

※掲載内容は、2018年3月時点での情報です。  
最新情報は、<https://labchem-wako.fujifilm.com>をご参照ください。

## 富士フイルム 和光純薬株式会社

本 社 〒540-8605 大阪市中央区道修町三丁目1番2号 TEL: 06-6203-3741 (代表)  
東京本店 〒103-0023 東京都中央区日本橋本町二丁目4番1号 TEL: 03-3270-8571 (代表)

- 九州営業所
- 中国営業所
- 東海営業所
- 横浜営業所
- 筑波営業所
- 東北営業所
- 北海道営業所



フリーダイヤル 0120-052-099

試薬URL: <https://labchem-wako.fujifilm.com>

■ FUJIFILM Wako Chemicals U.S.A. Corporation  
1600 Bellwood Road, Richmond, VA 23237, USA  
TEL: +1-804-714-1920 FAX: +1-804-271-7791

■ FUJIFILM Wako Chemicals Europe GmbH  
Fuggerstr 12, 41468 Neuss, Germany  
TEL: +49-2131-311-0 FAX: +49-2131-311-100