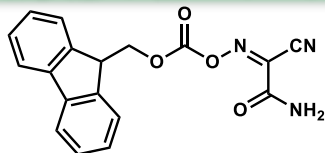


Fmoc-Amox



規格値・在庫状況

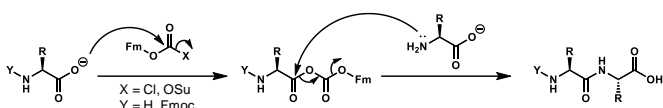
反応性の低いアミノ基のFmoc化に特に有用です



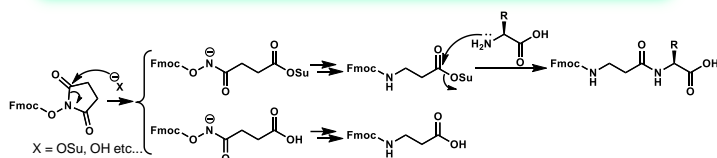
A00302	Fmoc-Amox	
CAS RN	1370440-28-0	
Price	5g	¥22,800
	25g	¥55,800

アミノ酸 (H-AA-OH) のアミノ基をFmoc-OSu、Fmoc-Clを用いてFmoc化する際、以下に示す副反応が併発し、目的化合物へのFmoc-ジペプチド (Fmoc-β-Ala-AA-OH、Fmoc-AA-AA-OH)、およびFmoc-β-Ala-OHのコンタミネーションが問題となることがあります。

活性エステル形成によるジペプチド生成



Lossen転位によるFmoc-β-Ala-OHとジペプチドの生成



Fmoc-Amoxはより穏和なFmoc化試薬で、上記のような副反応が低減されています。反応後に副生するAmoxは水洗により除去できます。立体障害により反応が進行しにくいN-メチルアミノ酸やα-メチルアミノ酸のFmoc化や、求核性の低い芳香族アミノ基のFmoc化に特に有用です。

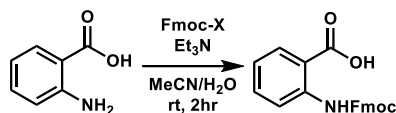
グリシンのFmoc化におけるジペプチド形成傾向^{Ref.1}



Fmoc-X	Fmoc-Gly-OH ⁴	Fmoc-Gly-Gly-OH ⁵
Fmoc-Cl ¹	89%	10-20%
Fmoc-OSu ²	68%	20%
Fmoc-Amox³	90.8%	0.06%

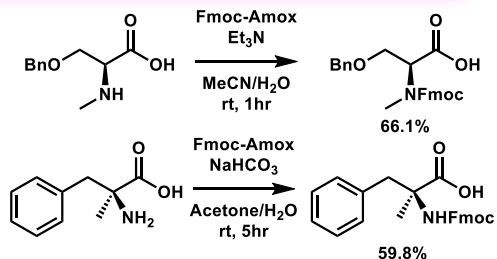
*1: Fmoc-Cl (1eq), Na₂CO₃ (2.5eq), 1,4-Dioxane/H₂O, rt, 2hr / *2: Fmoc-OSu (0.9eq), Na₂CO₃ (1.1eq), 1,4-Dioxane/H₂O, rt, 22hr / *3: Fmoc-Amox (1eq), NaHCO₃ (2.5eq), Acetone/H₂O, rt, overnight / *4: isolated yield. / *5: determined by HPLC.

芳香族アミノ基のFmoc化^{社内データ}

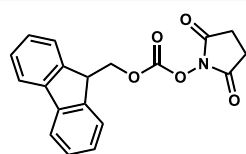


Fmoc-X	Yield
Fmoc-OSu	26.4%
Fmoc-Amox	74.0%

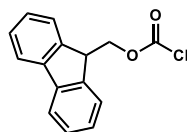
N-メチルアミノ酸、α-メチルアミノ酸のFmoc化^{社内データ}



当社お取り扱いFmoc化試薬



A00002	Fmoc-OSu	
CAS RN	82911-69-1	
Price	5g	¥6,300
	25g	¥14,000
	100g	¥38,200



B00033	Fmoc-Cl	
CAS RN	28920-43-6	
Price	5g	¥8,000
	25g	¥20,600
	100g	¥58,000

参考文献

- A. Kumar, A. Sharma, E. Haimov, A. El-Faham, B. G. de la Torre, F. Albericio, Fmoc-Amox, a Suitable Reagent for the Introduction of Fmoc, *Org. Process Res. Dev.* 2017, 21, 10, 1533-1541.
- S. N. Khatib, R. Subirós-Funosas, A. El-Faham, F. Albericio, Cyanoacetamide-based oxime carbonates: an efficient, simple alternative for the introduction of Fmoc with minimal dipeptide formation, *Tetrahedron*, 68 (2012) 3056-3062.
- E. Hlebowicz, A. J. Andersen, L. Andersson, B. A. Moss, Identification of Fmoc-β-Ala-OH and Fmoc-β-Ala-amino acid-OH as new impurities in Fmoc-protected amino acid derivatives, *J. Pept. Res.* 2005, 65, 90-97.