

# 2-Picoline-Borane

## -還元的アミノ化試薬-

伸栄商事株式会社

東京都港区新橋 5-10-5

Shin-Ei Corporation

Shimbashi, Minato-ku, Tokyo 105-0004

Japan

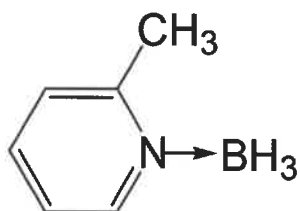
Phone : +81-3-5777-2041

Facsimile : +81-3-5777-2044

弊社では従来から、水素化ホウ素ナトリウム (NaBH<sub>4</sub>; 略称 SBH)、ジメチルアミノボラン (BH<sub>3</sub>-Me<sub>2</sub>NH) 等を、日本の化学会社様向けに販売してきました。この度、お客様のご要望に沿って、より扱い易く、合成試薬として応用範囲の広い、ピコリンボラン (2-Picoline-Borane; 略称 Pic-BH<sub>3</sub>) の販売を開始しました。

ピコリンボランは、安定な化合物で、含水溶媒でも使用できる穏和な還元剤です。特に、イミン還元を選択性が高い特徴があります。

### 2-Picoline-Borane (Pic-BH<sub>3</sub>) : Non-toxic Reductive Amination Reagent



CAS No. 3999-38-0 (mw 106.96)

融点 : 45-47 °C

外見 : Solid

色 : White

溶解性 : 水、シクロヘキサンにわずかに溶解、

MeOH、EtOH、THF、Diglyme、Benzene に溶解

安定性 : 極めて安定 (SC-DSC 試験 &gt;300 °C)

反応 : 還元的アミノ化反応は、MeOH のようなプロトン性有機溶剤や含水溶剤だけでなく、無溶媒でも進行する

#### 【1】2-Picoline-Borane の特徴

2-Picoline-Borane (Pic-BH<sub>3</sub>) は以下の様な特徴を有しています。

- ・安定な結晶で、秤量・運搬などに取り扱いやすい。
- ・熱的に安定で、加熱 (140°C) しても分解せず、冷却後の融点は変わらない。
- ・長時間保存しても顕著な分解はしない。(一部分解しても再結晶で精製可能)
- ・ピリジンボラン (BH<sub>3</sub>-Py) と比較して酸性条件下でやや安定、プロトン性有機溶媒や水中において BH<sub>3</sub>-Py より安定。
- ・緩和な還元剤であり、イミン還元を選択性が高い。
- ・無水条件を必要としない。

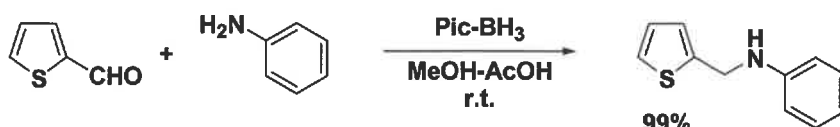
<参考>他の還元的アミノ化試薬との比較

還元剤	特 徴
BH <sub>3</sub> ・Py	熱に不安定で、加熱すると爆発的に分解（54℃以上で自己発熱して分解・火災、爆発の恐れ）長時間保存で分解（貯蔵期間は6か月以内）精製困難
NaBH <sub>3</sub> CN	試薬自体強い毒性。毒性副生物が生成。 工業的使用が制限される。
NaBH(OAc) <sub>3</sub>	使用溶剤はCH <sub>2</sub> Cl <sub>2</sub> 、ClCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl、THF、MeCN 1分子中還元性水素が1個で還元効率が低い。水中で分解する。

この様に Pic-BH<sub>3</sub> は、①溶媒の種類を問わずに使用でき、②安定な化合物であり、③還元的アミノ化反応の選択制が高く、④且つ HCN といった毒物を生じない為、合成化学の分野から生化学の分野まで使用事例が広がって来ています。

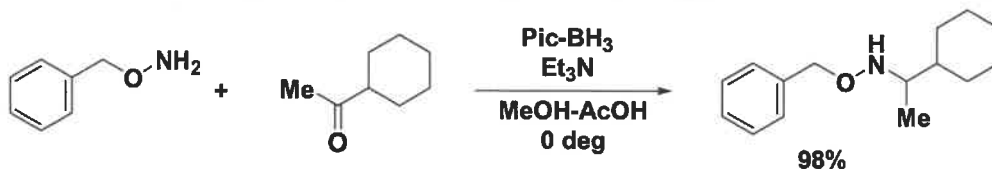
【2】2-Picoline-Borane (Pic-BH<sub>3</sub>)の使用事例

(1) アルデヒド/ケトンとアミンによる還元的アミノ化反応



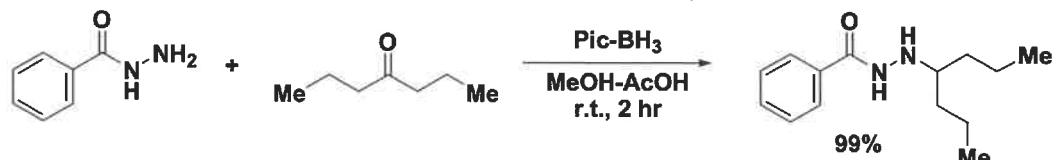
(JP 6598219 B2 (2019.10.30)、実施例 5a ; Firmenich Incorporated)

(2) アルコキシアミン誘導体とカルボニル化合物から N-置換アルコキシアミンの合成



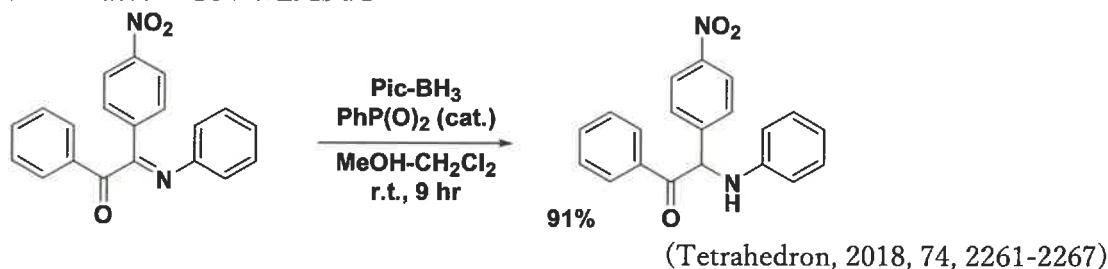
(Heterocycles, 2009, 78, 463-470)

(3) ヒドラジドとカルボニル化合物から N-置換ヒドラジド) の合成

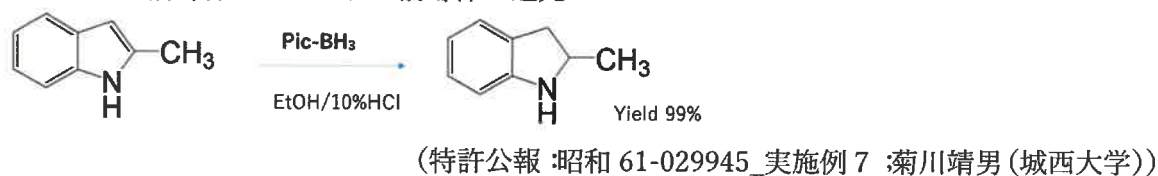


(Synthesis, 2014, 46, 455-464.)

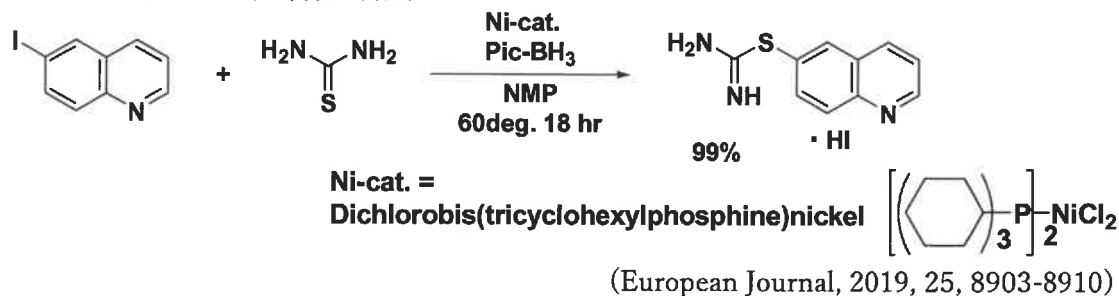
## (4) C=N 結合の選択的還元反応



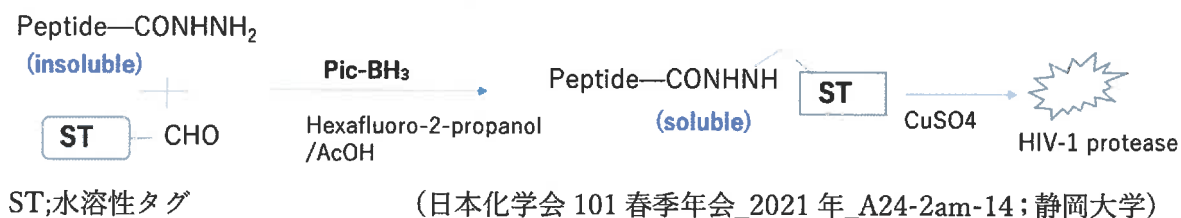
## (5) インドール誘導体をインドリン誘導体へ還元



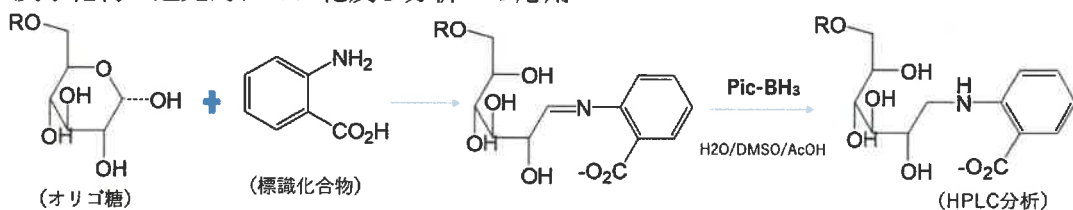
## (6) 無臭チオフェノール誘導体の合成



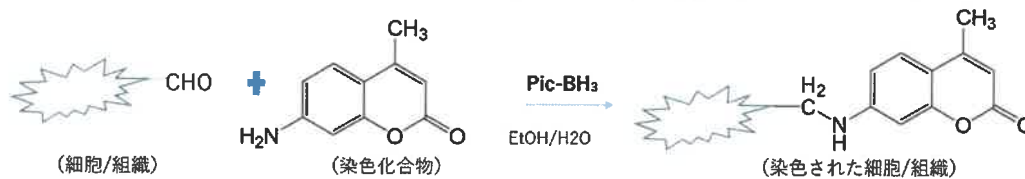
## (7) 難溶性ペプチドへの新規水溶性タグ導入



## (8) 炭水化物の還元的アミノ化及び分析への応用

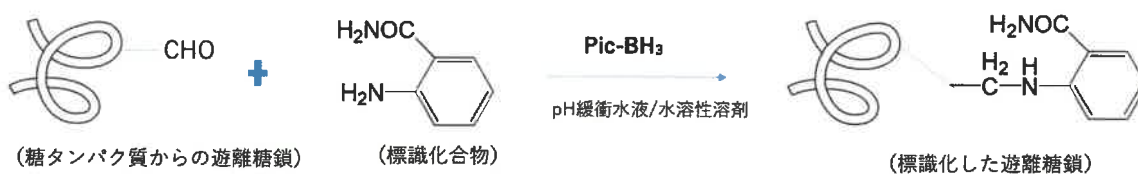


(9) 細胞、組織の染色への利用（アルデヒド基を有する物質を還元的アミノ化反応で染色）



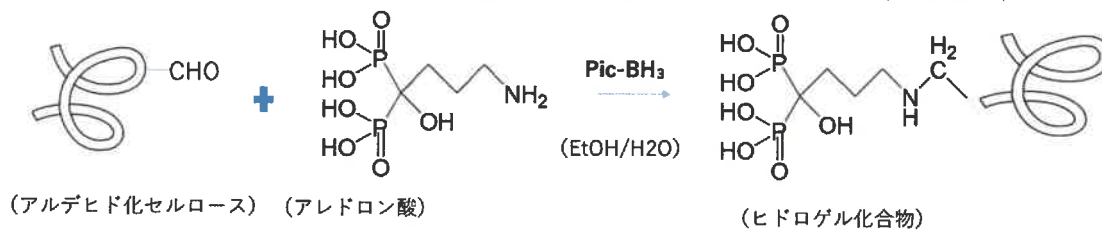
(JP 6950922 B2, 登録日 2021.09.28；名古屋市立大学)

(10) 糖タンパク質の糖鎖に標識試薬を結合させる工程に使用（糖タンパク質の検出）



(JP 6142973 B1, 登録日 2017.05.19；住友ベークライト(株))

(11) セルロースナノファイバとホスホン酸基を有するヒドロゲルの合成（人工骨用）



(JP 2019-208862 A、公開日 2019.12.12；(国・法人) 物質・材料研究機構)

以上