

## 2-Picoline-Borane

-還元的アミノ化試薬-

伸栄商事株式会社

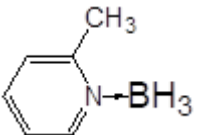
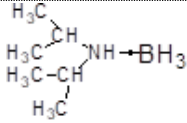
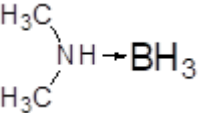
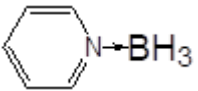
東京都港区新橋 2-12-11  
新橋 27MT ビル

Phone : 03-5157-2821

Facsimile : 03-5157-2827

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-B) の販売を開始しました。下記例示商品以外でも取り扱っておりますので、お気軽にお問い合わせください。

## 【1】Amine-Borane 化合物表 ; 還元的アミノ化試薬 (各種合成向け)

英名/和名	構造式	CAS No. /化審法	物理的性質等
Picoline-Borane (PIC-B)		CAS; 3999-38-0 化審法：少量新規 安衛法：8-(1)-3936	白色～うす黄色、粉末～結晶固体 融点：48(44-47) °C 極めて安定 (SC-DSC 試験>300 °C) MeOH、THF、Diglyme、Benzene に 容解
Diisopropylamine- Borane		55124-35-1	白色～うす黄色、固体/液体 融点：21 °C 空气中、湿気条件で安定
Dimethylamine- Borane		74-94-2	ほとんど白色、結晶～粉末固体 融点：33～37 °C 化学メッキ (ニッケル) に用いられる
Pyridine-Borane		110-51-0	無色～琥珀色、液体 融点：10-11 °C 54°C以上で自己発熱し分解する
<参考> Sodium Borohydride	NaBH <sub>4</sub>	16940-66-2	無色、固体 融点: 400°C ケトン、アルデヒド基の還元 に用いられる
<参考> sodium cyanoborohydride	NaBH <sub>3</sub> CN	25895-60-7	無色、固体 融点: 241°C (分解) 還元的アミノ化反応に用いられる

## 【2】 Picoline-Borane (PIC-B) の特徴

PIC-B は以下の様な特徴を有しています。

1. 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。
2. 緩和な還元剤で、無水条件を必要とせず簡単な操作で容易に還元的アミノ化を行える。
3. 長時間保存しても顕著な分解はしない。
4. プロトン性有機溶剤、含水溶剤、無溶媒で使用できる。

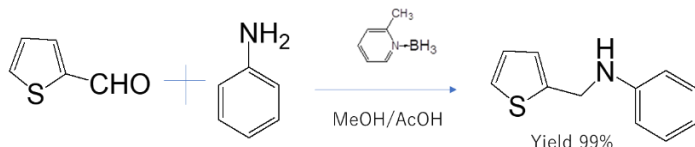
## &lt;参考&gt; 代表的な還元的アミノ化反応試薬の比較

還元剤	特 徴
Picoline Borane (PIC-B)	<ul style="list-style-type: none"> <li>・ 安定な結晶であり、秤量・運搬などに取り扱いやすい。</li> <li>・ 緩和な還元剤であり、イミン還元を選択性が高く、無水条件を必要としないので簡単な操作で容易に還元的アミノ化を行える。</li> </ul>
Pyridine Borane	<ul style="list-style-type: none"> <li>・ 水と接触して分解する。54°C以上で自己発熱し分解する。(貯蔵期間：6ヶ月)</li> <li>・ 生化学の分野で還元アミノ化剤として、また、無電解メッキ用還元剤として使用される。シアノボロハイドライドのような毒性はない。</li> </ul>
NaBH <sub>3</sub> CN	<ul style="list-style-type: none"> <li>・ 穏和な還元剤で、イミンを還元し、還元的アミノ化反応に用いられる。(Borch反応)</li> <li>・ 溶媒として、水系も使用できるが、毒性の強い副生物が生成する。</li> </ul>

この様に、①PIC-B は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、生化学の分野での使用事例が広がって来ています。

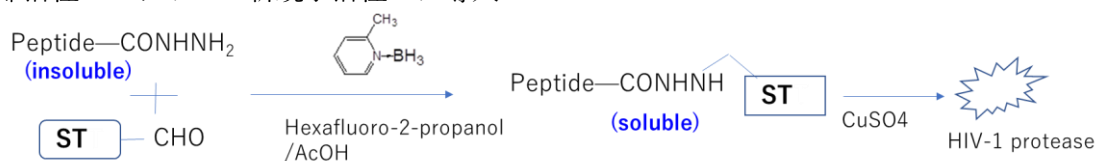
## 【3】 Picoline-Borane (PIC-B)の使用事例

## (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



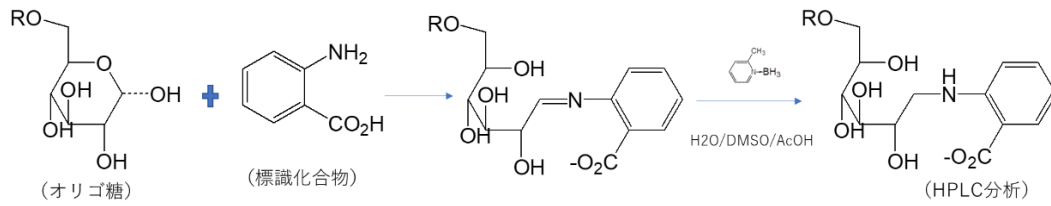
(JP 6598219 B2 (2019.10.30)、実施例 5a ; Firmenich Incorporated)

## (2) 難溶性ペプチドへの新規水溶性タグ導入



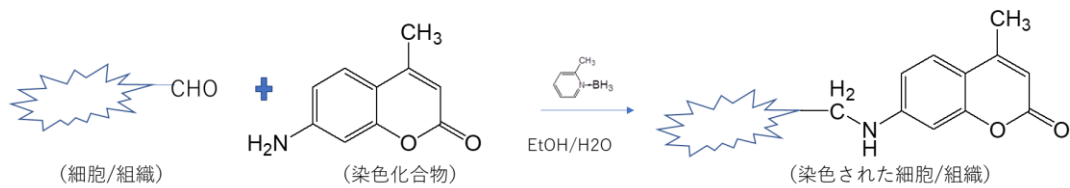
(日本化学会 101 春季年会\_2021 年\_A24-2am-14 ; 静岡大学)

## (3) 炭水化物の還元的アミノ化及び分析への応用



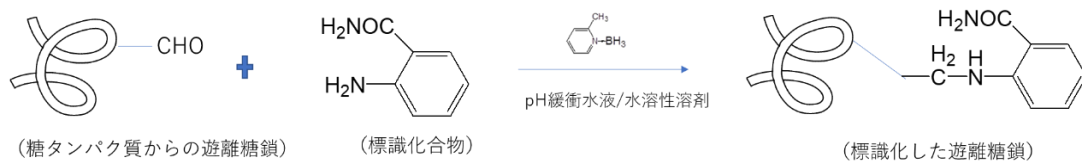
(JP 2013-506115 / WO 2011-038873 ; LEIDEN 大学メディカルセンター)

## (4) 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)



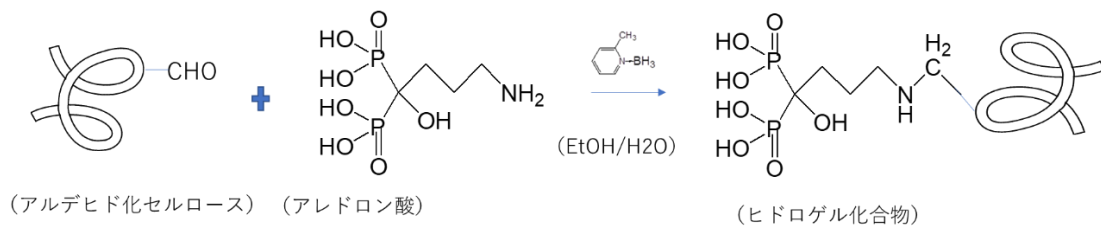
(JP 6950922 B2, 登録日 2021.09.28 ; 名古屋市立大学)

## (5) 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)



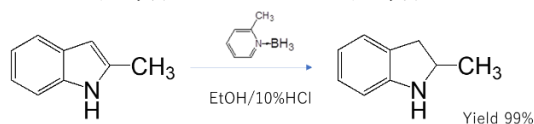
(JP 6142973 B1, 登録日 2017.05.19 ; 住友ベークライト(株))

## (6) 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)

## (7) インドール誘導体をインドリン誘導体へ還元



(特許公報：昭和 61-029945\_実施例 7 ; 菊川靖男 (城西大学))