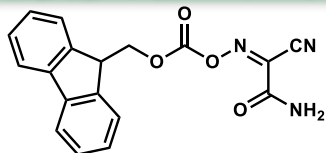


## Fmoc-Amox



規格値・在庫状況

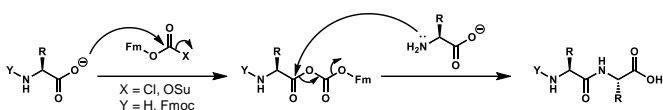
### 反応性の低いアミノ基のFmoc化に特に有用です



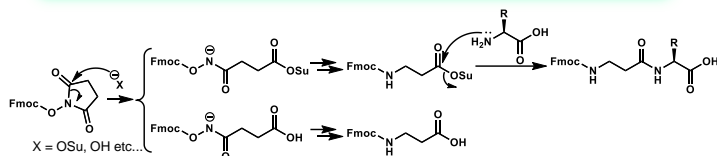
A00302	Fmoc-Amox	
CAS RN	1370440-28-0	
Price	5g	¥22,800
	25g	¥55,800

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。

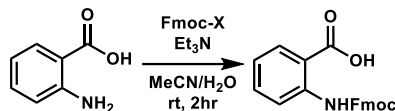
#### グリシンのFmoc化におけるジペプチド形成傾向<sup>Ref.1</sup>



Fmoc-X	Fmoc-Gly-OH <sup>4</sup>	Fmoc-Gly-Gly-OH <sup>5</sup>
Fmoc-Cl <sup>1</sup>	89%	10-20%
Fmoc-OSu <sup>2</sup>	68%	20%
<b>Fmoc-Amox<sup>3</sup></b>	<b>90.8%</b>	<b>0.06%</b>

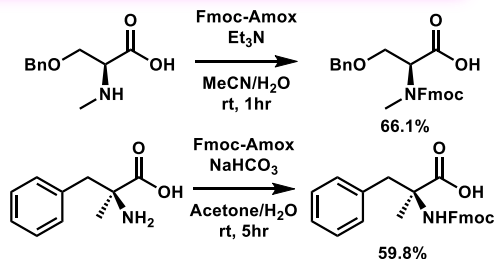
\*1: Fmoc-Cl (1eq), Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (2.5eq), 1,4-Dioxane/H<sub>2</sub>O, rt, 2hr / \*2: Fmoc-OSu (0.9eq), Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (1.1eq), 1,4-Dioxane/H<sub>2</sub>O, rt, 22hr / \*3: Fmoc-Amox (1eq), NaHCO<sub>3</sub> (2.5eq), Acetone/H<sub>2</sub>O, rt, overnight / \*4: isolated yield. / \*5: determined by HPLC.

#### 芳香族アミノ基のFmoc化<sup>社内データ</sup>

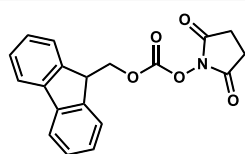


Fmoc-X	Yield
Fmoc-OSu	26.4%
<b>Fmoc-Amox</b>	<b>74.0%</b>

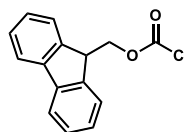
#### N-メチルアミノ酸、α-メチルアミノ酸のFmoc化<sup>社内データ</sup>



#### 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.

