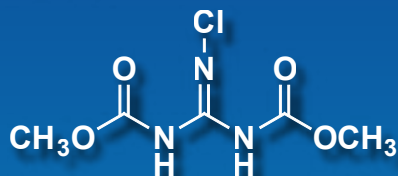
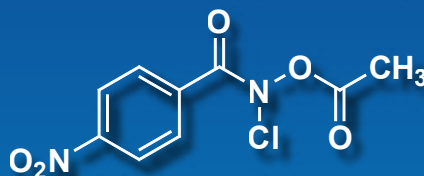


# ヘテロ環の位置選択的ハロゲン化に 有用な高反応性 塩素化剤・臭素化剤



**2-Chloro-  
1,3-bis(methoxycarbonyl)guanidine**  
1g 3,500円 / 5g 16,000円 / 25g 60,000円  
[C4028]



**N-Acetoxy-N-chloro-  
4-nitrobenzamide**  
1g 10,000円 / 5g 35,000円  
[A3694]

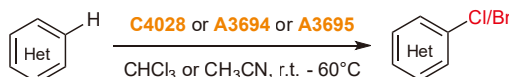


**N-Acetoxy-N-bromo-  
4-nitrobenzamide**  
1g 11,000円 / 5g 35,500円  
[A3695]

## 特長

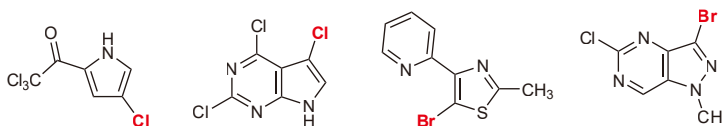
- 取り扱いやすい固体
- 多数の反応点をもつ複雑なヘテロ環も、温和な条件で位置選択的にハロゲン化可能
- マルチグラムスケール・連続フロー合成にも適用可能
- 創薬研究における、後期官能基化に最適

## 利用例

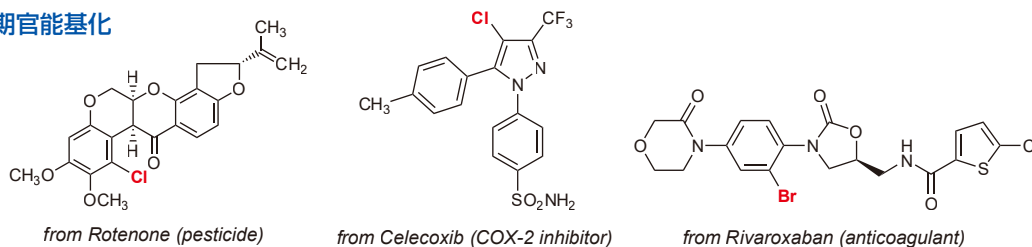


C4028<sup>1)</sup>、A3694、A3695<sup>2)</sup>は、従来のハロゲン化剤 (Cl<sub>2</sub>、Br<sub>2</sub>、NBS、NCS、TCCA など) では反応が進行しにくい基質に対しても高い反応性を示します。A3694は、アノマーアミド構造に起因する高い反応性をもつため<sup>2)</sup>、C4028で塩素化が不十分な場合でも、A3694を利用すると改善が期待できます。

### ハロゲン化ビルディングブロック合成



### 生理活性物質の後期官能基化



生理活性物質へのクロロ基導入は、薬効、クリアランス、薬物動態に大きな影響を与えることから、「マジッククロロ効果」として報告されました<sup>3)</sup>。「マジッククロロ効果」は、フッ素原子による「ブロック効果」や「ミミック効果」、メチル基による「マジックメチル効果」とともに、注目を集めています。

- 引用文献 1) R. A. Rodriguez, P. S. Baran, *et al.*, *J. Am. Chem. Soc.* **2014**, *136*, 6908. <https://doi.org/10.1021/ja5031744>  
2) Y. Wang, P. S. Baran, *et al.*, *Nat. Chem.* **2024**, *16*, 1539. <https://doi.org/10.1038/s41557-024-01539-4>  
3) D. Chiodi, Y. Ishihara, *J. Med. Chem.* **2023**, *66*, 5305. <https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.2c02015>

## 関連製品

**N-Chlorosuccinimide (= NCS)**  
**N-Bromosuccinimide (= NBS)**

25g 1,900円 / 100g 4,500円 / 500g 13,100円 [C0291]  
25g 1,900円 / 100g 3,100円 / 500g 8,400円 [B0656]

## 東京化成工業株式会社

### 試薬製品について

■本社営業部 〒103-0001 東京都中央区日本橋小伝馬町 16-12 T-PLUS 日本橋小伝馬町8階  
Tel: 03-3668-0489 Fax: 03-3668-0520 E-mail: Sales-JP@TCIchemicals.com

■大阪営業部 〒541-0041 大阪府大阪市中央区北浜1-1-21 第2中井ビル1階  
Tel: 06-6228-1155 Fax: 06-6228-1158 E-mail: osaka-s@TCIchemicals.com

### スケールアップ、受託サービス(合成・開発・製造)について

□化成品営業部 〒103-0001 東京都中央区日本橋小伝馬町 16-12 T-PLUS 日本橋小伝馬町8階  
Tel: 03-5651-5171 Fax: 03-5640-8021 E-mail: finechemicals@TCIchemicals.com

### 弊社製品取扱店

本誌掲載の化学品は試験・研究用のみ使用するものです。化学知識のある専門家以外の方のご使用はお避けください。目録や製品情報等、掲載内容の変更を予告なく行う場合があります。内容の一部または全部の無断転載・複製はご遠慮ください。