

^3H 標識化合物の合成

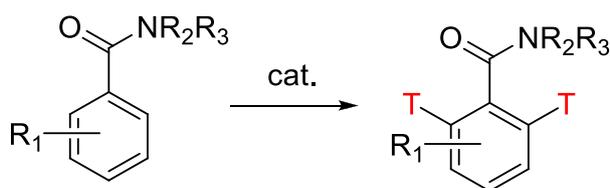
-トリチウム化の反応例-

トリチウムガスを利用した標識化が可能です。各種のトリチウム導入反応が可能です。

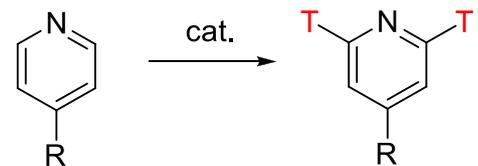
- 1) H/T 交換反応
- 2) ハロゲン/T 交換反応
- 3) 不飽和結合の水素添加反応
- 4) メチル化反応
- 5) 各種トリチウム化還元剤
- 6) トリチウム化還元剤の利用
- 7) ペプチドのトリチウム標識化への応用

1) H/T 交換反応

ターゲット化合物上のプロトンに触媒存在下、直接 ^3H と交換する反応です。前駆体を必要としないため最も簡便な方法ですが、反応が進行するかどうかは特定の官能基の有無によります。



Crabtree's catalyst:
 $[\text{IrCOD}(\text{py})(\text{PCy}_3)]\text{PF}_6$



other heterogeneous catalysts:
 PtO_2 , Pd, Rh

株式会社 ネモト・サイエンス

TEL : 0297-24-0781 E-mail: busi-dep@nemotosciene.co.jp

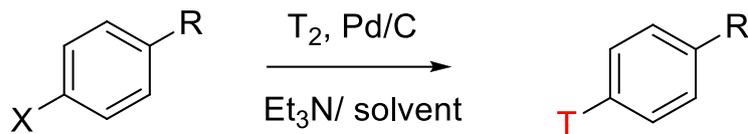
^3H 標識化合物の合成

-トリチウム化の反応例-

2) ハロゲン/T 交換反応

芳香環上のハロゲン原子を触媒存在下、 ^3H と交換する反応です。

標識したい位置にハロゲン原子を導入した前駆体を用いることでトリチウム原子の導入位置を指定することが可能です。



X: Cl, Br, I

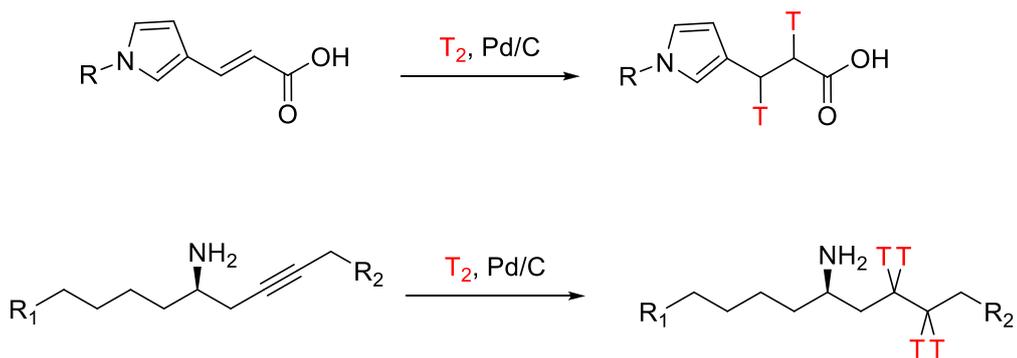
Cl/T exchange: 10~15 Ci/mmol

Br/T exchange: 15~20 Ci/mmol

I/T exchange: 20~25 Ci/mmol

3) 不飽和結合の水素添加反応

二重結合、三重結合を触媒存在下水素添加する反応です。トリチウム原子が複数個導入されるため高い比放射活性の標識体を得ることができます。



株式会社 ネモト・サイエンス

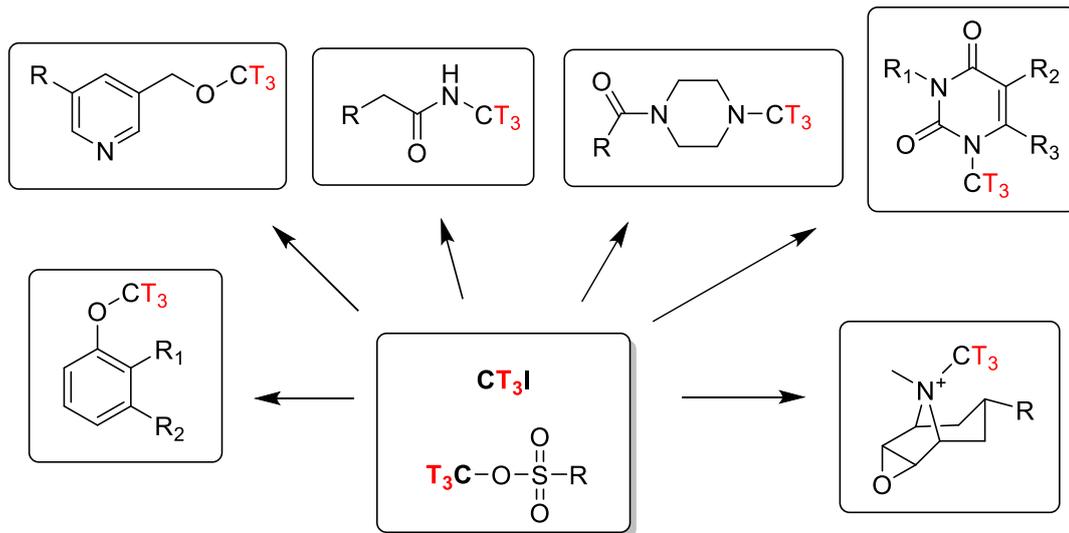
TEL : 0297-24-0781 E-mail: busi-dep@nemotosciene.co.jp

^3H 標識化合物の合成

-トリチウム化の反応例-

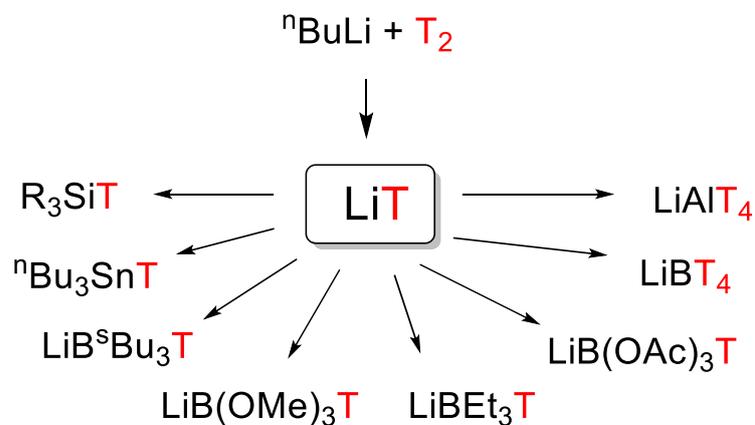
4) メチル化反応

CT_3I またはその等価体試薬である ^3H Methyl Nosylate による N-メチル化、O-メチル化反応です。 CT_3I と異なり ^3H Methyl Nosylate は取り扱いやすく、 CT_3I の等価体として使用することができます。高い比放射活性の標識体を得ることができます。



5) 各種トリチウム化還元剤

トリチウムガスと $^n\text{BuLi}$ より in house で調整した LiT を中間体として様々なトリチウム化還元剤を標識体合成に利用することが可能です



株式会社 ネモト・サイエンス

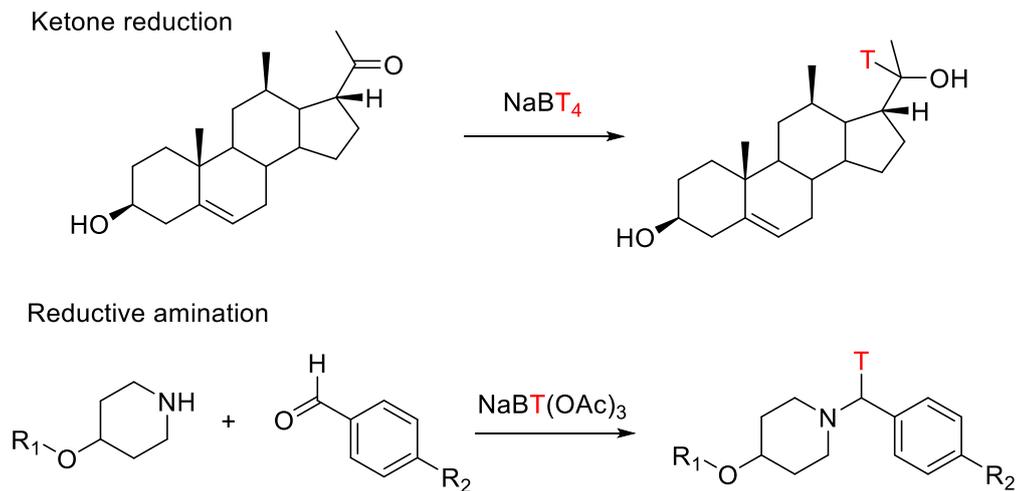
TEL : 0297-24-0781 E-mail: busi-dep@nemotosciene.co.jp

^3H 標識化合物の合成

-トリチウム化の反応例-

6) トリチウム化還元剤の利用

トリチウム化還元剤を用いたケトンの還元、還元的アミノ化によるトリチウム導入が可能です。



7) ペプチドのトリチウム標識化への応用

H/T 交換反応、ハロゲン交換反応などをペプチドのトリチウム標識化に応用することができます。

