



## 医薬品などの開発に役立つ新しい化学反応

### 「直接エナンチオ収束反応」の開発に成功

#### 研究成果のポイント

- ・ 医薬品などの開発に重要な光学活性化合物の新合成法「直接エナンチオ収束反応」を開発
- ・ 安価な原料からでも、光学活性化合物を直接生産することができる画期的方法
- ・ 医薬品や液晶ディスプレイ材料などの低コスト生産に威力を発揮すると期待

#### 研究成果の概要

北海道大学大学院理学研究院の伊藤肇准教授は、同大学院生國井峻氏、澤村正也教授と共同で、「直接エナンチオ収束反応」という新しい反応の開発に成功しました。

これは医薬品や液晶ディスプレイ材料などの開発に重要な物質である光学活性化合物が効率よく合成できる全く新しい反応です。

一般に光学活性化合物は合成が困難なためコストが高いという欠点があります。この反応は、安価に入手できるラセミ混合物という原料から、純粋な光学活性化合物に直接高効率で変換できるため、医薬品などの合成プロセスの簡素化と大幅なコストダウンにつながると期待されます。

本研究成果は、科学誌『Nature Chemistry』の電子版で2010年8月29日（英国時間）に公開されます。

#### 論文発表の概要

研究論文名：Direct enantio-convergent transformation of racemic substrates without racemization or symmetrization (ラセミ化及び対称化を伴わないラセミ基質の直接エナンチオ収束反応)

著者：伊藤肇（北海道大学大学院理学研究院，JST さきがけ），國井峻（北海道大学大学院理学研究院），澤村正也（北海道大学大学院理学研究院）

公表雑誌：Nature Chemistry 電子版 <http://www.nature.com/nchem/>

公表日：日本時間（現地時間）8月30日午前3時00分（英国時間8月29日午後6時00分）

※本研究は、日本学術振興会科学研究費補助金、独立行政法人科学技術振興機構（JST）戦略的創造研究推進事業さきがけの助成を受けています。

## 研究成果の概要

### (背景)

光学活性物質は、医薬品や液晶ディスプレイ材料などの開発に必要な化合物ですが、その合成に適した構造を持つ原料に限られるため、その生産には高いコストを要します。ラセミ混合物と呼ばれる物質は、対称な構造を持つ二種類の光学活性化合物の混合物で、一般に合成が簡単で安価に得られます。しかしこのラセミ混合物を原料として光学活性化合物を効率よく合成することは、一部をのぞいて困難とされてきました。

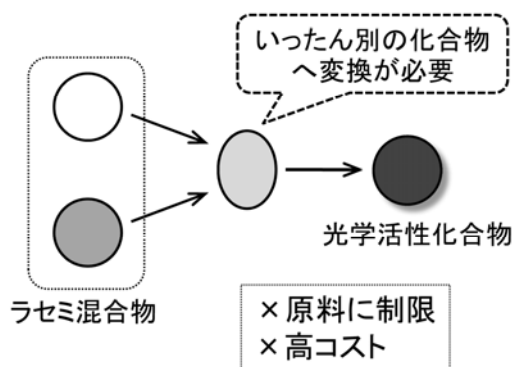
### (研究手法)

過去の方法では、ラセミ混合物から光学活性化合物を合成するプロセスの中で、二種類の光学活性化合物の混合物であるラセミ混合物をいったん別の構造を持つ化合物に変換する必要があり、これがラセミ混合物からの光学活性体の合成を困難にする一因となっていました。伊藤准教授と大学院生國井氏は、ラセミ混合物に含まれる光学活性化合物それぞれから二つの別の反応経路を通して直接目的の光学活性体に変換する新反応「直接エナンチオ収束反応」が可能ならばこの問題を解決できると考え、この反応の設計、探索を行ないました。

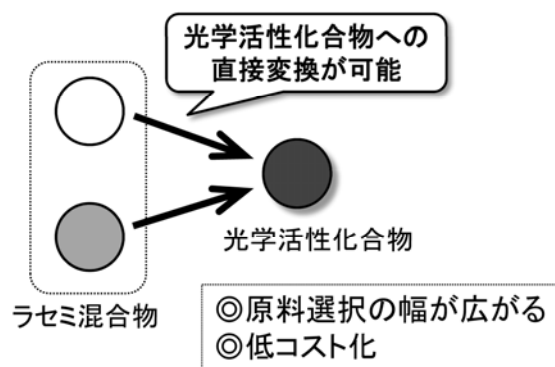
### (研究成果)

研究の結果、伊藤准教授および國井氏は、銅を含むある種の触媒を用いて不斉求核的ホウ素化という反応を行うと、ラセミ体第三級アリルエーテルという化合物から、光学活性有機ホウ素化合物という化合物を合成できることを発見しました。これは人工触媒によるラセミ体の「直接エナンチオ収束反応」に成功した世界で初めての例です。さらにこの反応で得られた光学活性有機ホウ素化合物を利用して、医薬品などの開発に重要な全炭素四級不斉中心という特殊な構造を持つ光学活性化合物の高効率合成にも成功しました。

#### ■ これまでの方法 ■



#### ■ 新しい方法 ■



### (今後への期待)

この研究により、これまでの方法では利用できなかった安価なラセミ混合物を、高い価値を持つ光学活性化合物へと直接変換できる新たな方法の存在が明らかになりました。この方法が発展すれば、医薬品や液晶ディスプレイ材料などの合成プロセスの簡素化と大幅なコストダウンにつながると期待されます。

## お問い合わせ先

北海道大学大学院理学研究院化学部門・准教授・伊藤 肇 (いとう はじめ)

TEL: 011-706-4647 FAX: 011-706-3749 E-mail: hajito@sci.hokudai.ac.jp