



有機ホウ素化合物の安価・簡単・安全な合成法を開発

研究成果のポイント

- ・鈴木クロスカップリング反応などに利用され、医薬品や液晶などの重要な原材料となる有機ホウ素化合物の安価・簡単・安全な新しい合成方法「シリルボラン法」を開発。
- ・有機ホウ素化合物の合成に必要な触媒・活性化剤のコストが従来法と比べ 1/20 となる。
- ・これまでの方法と異なり、重金属触媒や発火性のある反応剤を用いないため安全である上、環境にも優しい。
- ・医薬品や液晶、有機 EL 材料などの大幅なコストダウンが期待できる。

研究成果の概要

鈴木カップリングの原料である有機ホウ素化合物の合成が簡単・安価になる新しい方法を発見しました。この方法では有機ホウ素化合物合成の触媒コストが従来法と比べ約 1/20 となる上、重金属を全く使わない環境に優しいという利点を持ちます。

論文発表の概要

研究論文名 : Anomalous Reactivity of Silylborane: Transition Metal-free Boryl Substitution of Alkyl, Alkenyl, and Aryl Halides with Silylborane/ Alkoxy Base Systems (シリルボランにおける予想外の反応性 : シリルホウ素/塩基反応系による遷移金属触媒を用いない有機ハロゲン化物のホウ素化反応)

著者 : 山本英治・泉清孝・堀田優子・伊藤肇

所属 : 北海道大学大学院工学研究院・フロンティア化学教育研究センター (*)

公表雑誌 : 米国化学会誌 (J. Am. Chem. Soc.) (***)

公表日 : 米国東部時間 2012 年 11 月 21 日

(*) 物質変換と物質創製を担う最先端化学に関する研究を行うとともに、当該研究を推進する次世代のグローバルリーダーを養成するために平成 24 年 6 月に北海道大学に設立された組織。

(**) 本研究は、最先端・次世代研究開発支援プログラム(日本学術振興会)の助成により実施されました。

(***) 2011 年インパクトファクター (I. F.) 9.9

研究成果の概要

(背景)

有機ホウ素化合物は、2010年のノーベル化学賞の受賞対象となった鈴木カップリング反応で用いられる重要な物質です。この化合物から医薬品や液晶、有機EL材料などの高付加価値化合物を合成することができます。しかし、有機ホウ素化合物を合成するためには、従来はパラジウムなどの高価な重金属触媒やリチウムなどの発火性金属が必要（重金属触媒法：下図(上)）で、コストや安全面で問題がありました。

(研究手法)

これまでに用いられてきたホウ素化反応では、ホウ素を主に含有するホウ素化剤が用いられてきました。この場合、重金属触媒が必要ですが、これはホウ素化剤の反応性が低いためであると我々の研究グループは考え、より高い反応性をもち、重金属触媒を必要としない新しいホウ素化剤の探索を行いました。

(研究成果)

様々なホウ素化剤や活性化剤の組み合わせを検討したところ、ホウ素化反応剤としてこれまで使われてきたことのない、ケイ素を含むホウ素化合物「シリルボラン」と、安価な塩基性活性化剤を組み合わせた場合、ホウ素化反応が極めて効率良く進行することを発見しました（シリルボラン法：下図(下)）。この反応は、これまでのホウ素化剤を用いた場合に必要とされていた、高価な重金属触媒を必要としない上、従来法に比べて多くの種類の有機ホウ素化合物を合成することができました。

■ これまでの方法： 重金属触媒法



ホウ素を有機物に結びつける際に**重金属触媒**または発火性金属が必要

欠点
× 重金属触媒が高価
× 発火性金属の取り扱いが難しい

■ 新しい方法： シリルボラン法



※ケイ素を含む**シリルボラン**の活用により**重金属触媒が不要**に！
(安価な塩基性活性化剤でOK)
※ しかも反応性も向上

利点
○ 活性化剤の**コスト 1/20**
○ **安全性向上**
○ **簡便な変換手順**

(今後への期待)

これまでに用いられていたパラジウムや白金などの重金属触媒に比べて、塩基性活性化剤はコストが約1/20であるため、有機ホウ素化合物の合成コストが大幅にダウンできます。また、この反応は操作が簡便で、かつマグネシウムやリチウムなどの発火性の化合物を使わない安全な方法であるうえ、反応のスピードも早く、有機ホウ素化合物を用いて作られている医薬品や液晶材料等の最終製品のコストダウンや開発期間の短縮につながると考えられます。さらにこの研究を通じて、ケイ素を含むホウ素化合物の新しい性質を発見したため、これを応用し別の新しい反応を開発する手がかりになると考えられます。



写真：研究を進めた主なメンバー

左より 山本英治（博士研究員），泉清孝（工学部4年生），伊藤肇（工学研究院 教授）

お問い合わせ先

所属・職・氏名：北海道大学大学院工学研究院 教授 伊藤 肇（いとう はじめ）

TEL：011-706-6561 FAX：011-706-6561 E-mail：hajito@eng.hokudai.ac.jp

ホームページ：<http://labs.eng.hokudai.ac.jp/labo/organoelement/>

本研究の詳細：http://labs.eng.hokudai.ac.jp/labo/organoelement/?page_id=2430

フロンティア化学教育研究センターHP：<http://www.eng.hokudai.ac.jp/fcc/>