

光学活性アミノホスホン酸化合物の効率的な不斉合成法

中村修一（未来材料創成工学専攻）

技術概要

アミノホスホン酸類は、生理活性を有する化合物が多いため、その合成法の開発が期待されていた。当研究室は、これまでに合成が難しかった光学活性アミノホスホン酸の簡便な供給を可能とした。また、環境にやさしい合成技術の開発にも成功した。

背景・従来技術

医薬品、ファインケミカルにおいて重要なアミノホスホン酸類は、今後、需要が高まると考えられるがその有効な供給方法が存在しなかった。

特徴

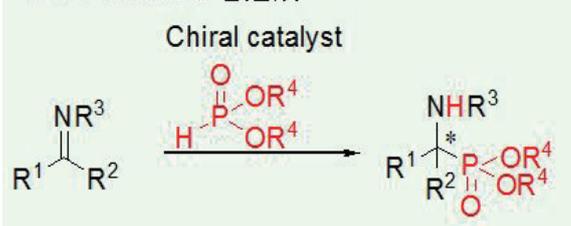
これまでに効率的合成が難しいとされていた光学活性アミノホスホン酸化合物の合成を、新

しい不斉触媒を開発することで可能とした。医薬品合成等では、様々な形態での合成手法が求められるため、 α -アミノホスホン酸合成では、除去が容易な保護基を用いる手法、環境にやさしい三成分連結型合成法を開発し、 β -アミノホスホン酸合成では、これまでに報告例のないアジリジンからの効率的合成手法を開発した。

実用化イメージ

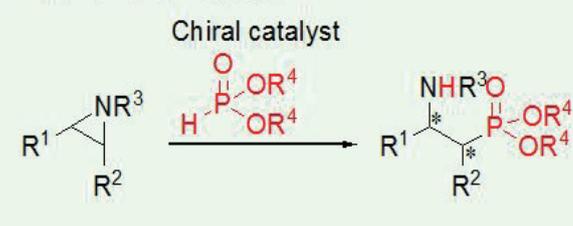
本技術における新規の不斉合成触媒の試薬としての実用化のみならず、それを用いた不斉合成法の医薬品候補化合物合成への利用、機能性材料合成への利用、有機合成反応への利用が期待できる。そのため、医薬品・ファインケミカル・農薬・化粧品・化成品メーカーにおいて実用化が期待される。

1. α -アミノホスホン酸合成



不斉触媒を用い、イミンへの垂リン酸エステル付加反応を行うことで、光学活性 α -アミノホスホン酸化合物の合成に成功しました。

2. β -アミノホスホン酸合成



不斉触媒を用い、アジリジンへの垂リン酸エステル付加反応を行うことで、光学活性 β -アミノホスホン酸化合物の合成に成功しました。

企業への提案

研究者から企業へのメッセージ

新しい不斉合成触媒や不斉合成技術の開発を行なっています。ご興味があれば、ご連絡ください。

文献・特許

- ・ 特願 2012-030435, 『ヘテロアレーンカルボニル化キナアルカロイド触媒とそれを用いる光学活性 β -アミノホスホン酸または β -アミノホスフィンの製造方法』
- ・ 特願 2009-197682, 『4 置換不斉炭素を有する α -アミノリン酸化合物の製造方法』
- ・ J. Am. Chem. Soc. 2012, 134(47), 19366-19369.
- ・ Adv. Synth. Catal. 2011, 353 (18), 3285-3289.
- ・ J. Am. Chem. Soc. 2009, 131(51), 18240-18241.

共同研究を希望するテーマ

- ・ 医薬品合成
- ・ 触媒開発
- ・ 農薬合成

医薬品候補化合物の簡便合成

試作品状況

無

提示
可

提供
可