

モノフルオロメチル化技術

柴田哲男（未来材料創成工学専攻）

技術概要

生理活性物質の活性向上に向けて、化合物にモノフルオロメチル基を導入することが現在の医薬、農業の探索研究において多く行われている。我々は独自のモノフルオロメチル化試薬を開発することで、様々なモノフルオロメチル基を持つ化合物の合成を可能にした。

背景・従来技術

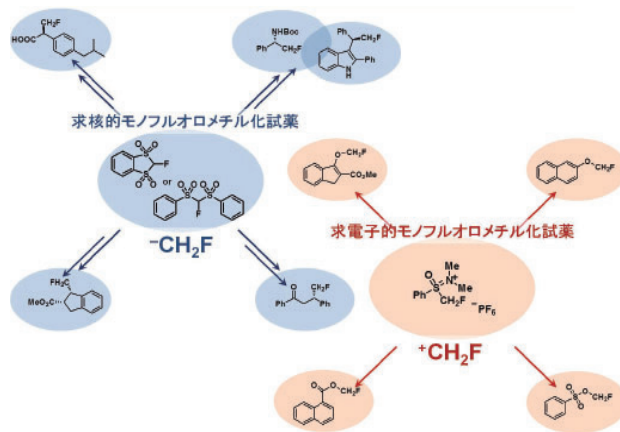
モノフルオロメチル基は、いくつかの生理活性物質に含まれているにもかかわらず、その有用な導入試薬が世の中になかったことから、その研究は殆どされてこなかった。特に不斉合成の観点からモノフルオロメチル基を直接的に化合物へ導入する研究は非常に限定的であった。

特徴

我々の研究室では直接的にモノフルオロメチル基を導入する手法の開発として求核的モノフルオロメチル化試薬、求電子的モノフルオロメチル化試薬をそれぞれ開発した。これらの試薬を用いれば、化合物の様々な部位へのモノフルオロメチル基の導入が可能である。

実用化イメージ

モノフルオロメチル化試薬は求核的なものと求電子的なものに大別される。それぞれ化合物に対して導入できる部分が異なるので、それぞれの試薬を必要に応じて使い分けることで、効率的にモノフルオロメチル基を導入できる。また適切な不斉配位子や触媒を用いることで、不斉合成へと展開できる。



独自のモノフルオロメチル化試薬を用いたモノフルオロメチル化反応の例

企業への提案

研究者から企業へのメッセージ

柴田研究室では有機フッ素化合物の合成の研究を行っています。医薬品や機能性材料（フタロシアニン）、サリドマイドなど幅広く研究をしています。フッ素のことやフッ素化合物に関することは何でもご相談ください。

文献・特許

- ・ Fukuzumi, T.; Shibata, N.; Sugiura, M.; Yasui, H.; Nakamura, S.; Toru, T. *Angew. Chem. Int. Ed.* 2006, 45, 4973.
- ・ Mizuta, S.; Shibata, N.; Goto, Y.; Furukawa, T.; Nakamura, S.; Toru, T. *J. Am. Chem. Soc.* 2007, 129, 6394.
- ・ Furukawa, T.; Shibata, N.; Mizuta, S.; Nakamura, S.; Toru, T.; Shiro, M. *Angew. Chem. Int. Ed.* 2008, 47, 8051.
- ・ Furukawa, T.; Kawazoe, J.; Zhang, W.; Nishimine, T.; Tokunaga, E.; Matsumoto, T.; Shiro, M.; Shibata, N. *Angew. Chem. Int. Ed.* 2011, 50, 9684.
- ・ Nomura, Y.; Tokunaga, E.; Shibata, N. *Angew. Chem. Int. Ed.* 2011, 50, 1885.

利用可能な設備・装置

- ・ NMR
- ・ HPLC
- ・ LCMS
- ・ GC
- ・ IR

共同研究を希望するテーマ

- ・ 医薬品中間体の合成法の開発
- ・ 合成プロセスの開発
- ・ 新規医薬品候補化合物の合成
- ・ 機能性材料の開発
- ・ 環境にやさしい合成法の開発
- ・ 不斉合成法の開発

独自試薬を用いた
CH₂F
基の導入

試作品状況

無

提示
可

提供
可