

2019年 2月 12日  
所属: 豊橋技術科学大学  
応用化学生命工学専攻  
氏名: 藤井琢真 印

## 2019 年度 助成 海外調査研究終了報告書 ※ゴシック文字で記入下さい。

渡航目的	<p>本研究室で開発した医農薬品の開発に応用が期待される不斉トリフルオロメチルシクロプロパン化反応について、台湾で行なわれる国際会議 ICCSE 2019にて口頭発表を行ない、情報収集と共に本研究成果を海外に発信する目的で渡航する。</p>
渡航日程と海外での成果(発表・調査など)	<p>渡航日程 2019年 11月16日 中部国際空港より桃園国際空港に到着 2019年 11月17日 大学見学 2019年 11月18-20日 ICCSE 2019への参加と口頭発表 2019年 11月21日 桃園国際空港より中部国際空港に到着</p> <p>海外での成果 多数の学術的に価値のある論文が発表された化学工学と化学に関する国際会議 2019 8th International Conference on Chemical Science and Engineering (ICCSE 2019)にて Highly diastereo- and enantioselective synthesis of trifluoromethyl-substituted cyclopropanes by using Ru(II)-Pheox catalyst の題目で口頭発表を行なった。口頭発表では化学工学の分野の専門家の方々から興味と意見を頂き、今後の研究に活かすことができる情報が得られた。他の発表をみることで自身の専門的知識を増やすことができた。発表後の交流会では多くの研究者の方と話すことができ、連絡先の交換も行なう事ができた。また、大学見学では台湾の一流大学での研究と教育の雰囲気を感じることができ、良い刺激が得られた。今回得られた知見と経験をもとに今後はさらに研究成果を積み、世界で活躍できる研究者を目指して研究を続けていきたい。</p>
研究内容の概要	<p>これまでに、トリフルオロメチルシクロプロパン構造の効果的な不斉構築に威力を発揮する触媒はコバルトサレン触媒とミオグロビン触媒(バイオ触媒)のわずか2例に限られている。どちらも良好な収率と光学純度で目的の化合物が得られる反応ではあるが基質によっては収率と立体選択性が低下するため幅広い基質に適用可能な触媒を用いた方法の開発が求められる。また、コバルト金属は比較的、高価な金属であるにも関わらず、触媒量が多く必要であるとともに、有毒なヒ素化合物が反応に不可欠となるといった課題が残されている。ミオグロビン触媒を用いた方法に関しては、生体触媒のpHや温度に対して不安定であるために複雑な反応システムとなっている。また、生体から抽出して利用するミオグロビン触媒は片方の立体制御のみしか行なうことができず、触媒の保存を含めて扱いが困難である。上記の観点から、両触媒を用いた方法は産業化するには難しく、医農薬品開発において増加している本構造の需要に対して実践的な導入法の開発が求められている。</p> <p>今回、我々は本研究室で開発したキラルルテニウム触媒を用いてこれまで報告されてきた中で最も実用化に近い触媒系を開発することに成功した。現在、不斉シクロプロパン化反応において効果的な触媒系はロジウムやコバルト触媒が主流ではあるがどちらも金属としては高価である。それと比べて、今回用いたルテニウムは比較的安価であるため、工業化に適しており本研究室で開発したキラル配位子(Pheox)はルテニウムを室温、添加剤無しで触媒として活用できる。本研究では、そのRu(II)-Pheox触媒を用いてトリフルオロメチルシクロプロパン構造の不斉合成法を検討した結果、目的の化合物を高立体選択的かつ高収率に合成することが見出された。最適化した条件を用いて基質の一般性の調査を行なうとステレン類だけでなく医農薬品に重要なビニルカルバメート類を含めた幅広い16種類の基質に対して良好な結果で適用できた。本触媒系はこれまでに報告された触媒系と比較し、より温和な条件下で高立体選択的かつ高収率で反応を進行させることができるため、今後、創薬研究においてトリフルオロメチルシクロプロパン構造の実践的な導入法として用いられることが期待されフッ素が導入された効果的な医農薬品の生産が加速されていくだろう。</p>

提出期限: 帰国後すみやかに助成金の「必要経費使途明細書」「領収書(原本)」と合わせて提出下さい。