

医薬品開発のための新規フッ素化剤およびフッ素化法の開発

研究の概要と特徴

- ◆ 最も安全かつ安価な求核的フッ素化剤の1つであるフッ化カリウム (KF) を用いる新規フッ素化剤 (HF-塩基錯体) の合成
- ◆ 合成した新規フッ素化剤 (HF-塩基錯体) を用いるフッ素化法の開発

研究の内容

【有機フッ素化合物】

- ◆ 医薬品の約20%
- ◆ 農薬の約30%

天然には殆ど存在しない

新規フッ素化剤およびフッ素化法の開発

- ◆ 問題点：従来のフッ素化剤の多くは取り扱い困難、非常に高価

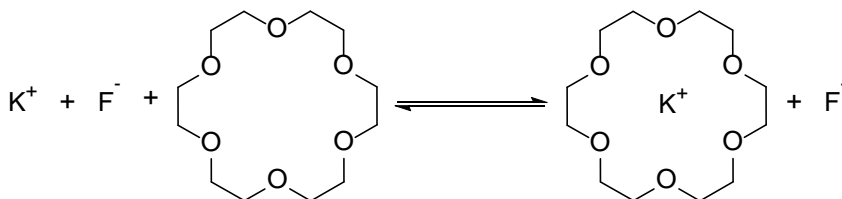
K. Müller, C. Faeh, F. Diederich, *Science* **2007**, 317, 1881–1886.

【最も安全かつ安価な求核的フッ素化剤：KF】

- ◆ 問題点：有機溶媒に難溶

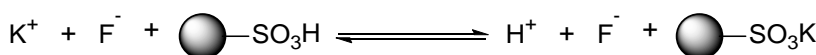


【従来法】 ◆ カリウムイオンをクラウンエーテルによって包接することでKFの溶解性を向上



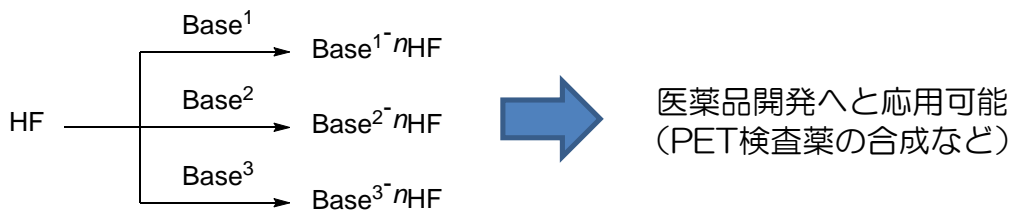
C. J. Pedersen, *J. Am. Chem. Soc.* **1967**, 89, 7017–7036.

【本手法】 ◆ カリウムイオンと固体酸のカチオン交換反応によってKFの溶解性を向上



T. Tajima, A. Nakajima, Y. Doi, T. Fuchigami, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2007**, 46, 3550–3552.

- ◆ 特徴：室温で20分撹拌するだけで定量的にHFを生成し、更に生成したHFと塩基と作用させることで種々の新規フッ素化剤 (HF-塩基錯体) を安全かつ迅速に合成可能



研究の効果並びに優位性

最も安全かつ安価な求核的フッ素化剤であるKFを活性化し、種々のフッ素化剤 (HF-塩基錯体) へと安全かつ迅速に誘導できることから、様々な医薬品開発へと応用可能

技術応用分野・企業との連携要望

- ◆ 新規フッ素化剤の開発
- ◆ 医薬品 (PET検査薬など) の合成法の開発