

フッ素化合物の新しい生成法の開発

◆有機フッ素化合物を合成する簡便な手法が開発された

2021年12月、山口大学大学院の研究グループは、医薬や農薬において重要な官能基の一つであるトリフルオロメチル基を特定の位置に導入する手法を新たに開発したと発表した。

フッ素は電気陰性度、安定性、親油性が高いため、フッ素置換基を化合物に導入することで、化合物の薬理効果や代謝安定性などの生物学的利用能が向上することが知られている。フッ素置換基のなかでも、特に、メチル基の3つの水素がフッ素に置換したトリフルオロメチル基を分子骨格に導入する方法の開発が注目されていた。

今回の研究では、アルケンの二官能基化反応という方法を応用し、トリフルオロメチル基を有するさまざまな化合物群を合成することに成功した。

今後、この反応を複雑な化合物に応用することで、これまでにない新しい含フッ素化合物を合成できる可能性がある。

◆有機フッ素化合物の新規合成法の開発に成功

22年1月、早稲田大学理工学術院の研究グループは、芳香環にフッ素原子を導入しながら環を開き、変形する「芳香環開環型フッ素化反応」の開発に成功したと発表した。

これまでは、芳香環の水素や置換基をフッ素に置き換えるものが多く、芳香環自体の形を変えるようなフッ素導入反応はほとんど知られていなかった。今回の研究では、窒素を含む芳香環にフッ素化剤を作用させることで、フッ素を導入しながら、芳香環の結合を切断し、有機フッ素化合物を合成することに成功した。

今回の研究により、フッ素が直接に結合する炭素原子に3個の炭素原子が結合した化合物である第三級フッ素化合物に変換でき、医薬品などを含む40種類以上の化合物を合成できた。

今回開発した方法は、複雑な化合物の合成を行う工程の終盤での適用も可能であり、新規医薬品候補化合物の合成などへの応用が期待できる。 【松村晴雄】