

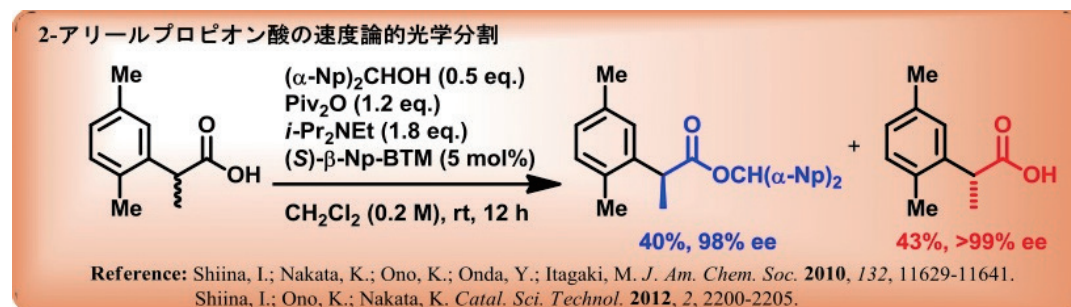
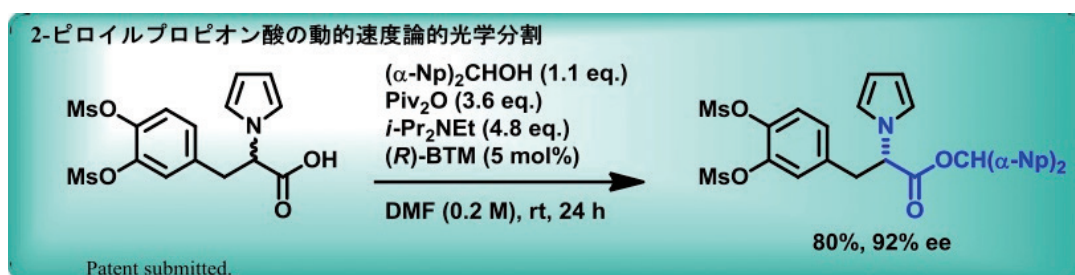
椎名 勇 Isamu SHIINA (東京理科大学 理学部第一部 応用化学科 教授)

## 研究の目的

不斉エステル化反応とラセミ化反応を組み合わせることで光学活性エステルを100%に近い収率で与える“動的・速度論的・光学分割反応 (DKR)”を開発しました。(I. SHIINA, K. ONO, K. NAKATA, *Catalysis – Science & Technology*, 2, 2200-2205 (2012). [Cover Feature Article] [Hot Article] [Most Accessed Article])

さらに今回、ラセミ $\alpha$ -アミノカルボン酸等価体を本反応に適用することでDKRを実施し、良好な選択性で光学活性アミノ酸保護体を与える新規合成法を発明しました。

## 研究の概要



- ・ラセミ体のカルボン酸を光学活性なカルボン酸エステルへと変換する技術
- ・光学活性2-アリールプロピオン酸エステルを100%に近い収率で合成
- ・光学活性 $\alpha$ -アミノ酸エステルを100%に近い収率で合成
- ・ラセミ医薬品や医薬中間体の合成後のラセミ体分離工程なしで、直接、一方のエナンチオマーを選択的に合成可能

## POINT

- ・ラセミ $\alpha$ -アミノ酸の選択的・合成
- ・ラセミ体の合成後の分離、分割不要
- ・100%に近い収率

## 今後の展開

- ・更なる合成方法、合成時間短縮等の検討
- ・基質適用範囲の拡大
- ・新規触媒の創製
- ・創薬企業、医薬中間体企業、食品開発企業等との共同研究、公的研究費獲得を目指します。

- 関連制度: JST A-STEPハイリスク挑戦タイプ (平成26-29年度)
- 受賞歴: 日本化学会学術賞 (平成24年度)、井上学術賞 (平成26年度)、市村学術賞・功績賞 (平成26年度)
- 知的財産権: 特願2014-018887「光学活性カルボン酸エステルの製造方法」
- 試作品: あり ■ サンプル: 提供可能

