

「未来創薬への誘い」第45回会合
『創薬を支援する連続照射
マイクロ波反応の開発』

講師：有澤 光弘（ありさわ みつひろ）
大阪大学大学院薬学研究科 准教授

日時：2019年1月30日（水） 18:00～20:30

場所：千里ライフサイエンスセンタービル
講演会 6階 千里ルーム A 室（18:00～19:30）
懇親会 6階 千里ルーム B 室（19:30～20:30）

講演・懇親会ともに参加費無料

コーディネーター：中川 晋作（大阪大学大学院薬学研究科 教授）
小比賀 聡（大阪大学大学院薬学研究科 教授）

主催：公益財団法人 千里ライフサイエンス振興財団
〒560-0082 大阪府豊中市新千里東町1丁目4番2号
千里ライフサイエンスセンタービル20階

E-mail: sng-2019@senri-life.or.jp Tel: 06-6873-2001

<http://www.senri-life.or.jp>

【要 旨】

医薬品・農薬・有機 EL・色素など機能性材料の合成では反応釜を加熱することが一般的である。それは加熱により、分子の運動速度が速まり、反応が促進されることに起因する。一方、マイクロ波による加熱法は溶媒や基質そのものの分子振動により加熱することから、高効率な加熱方法として近年注目を集めている所であるが、従来のマイクロ波装置ではマイクロ波のエネルギーを有効利用できてないことや加熱による反応促進効果とマイクロ波独自の反応促進効果(いわゆる非加熱効果)との切り分けが困難なことが問題となっていた。

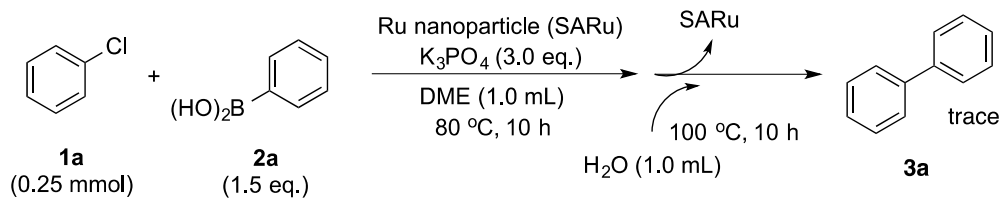
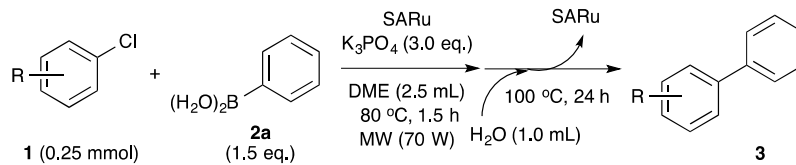


図1 従来の加熱方法(マイクロウェーブを含む)を用いた、ルテニウムナノ粒子触媒を用いた塩化ベンゼンとボロン酸誘導体とのリガンドフリー鈴木-宮浦カップリング反応



Run	Ar-Cl	Yield (%)	Run	Ar-Cl	Yield (%)
1		3a (93)	5		3k (76)
2		3b (60)	6		3n (83)
3		3g (52)	7		3o (70)
4		3d (84)	8		3r (65)

図2 新しいマイクロウェーブ装置を用いた、ルテニウムナノ粒子触媒 SARu による、塩化ベンゼンとホウ素化合物との鈴木-宮浦カップリング

ところで、一般的にルテニウムナノ粒子触媒を用いた塩化ベンゼンとボロン酸誘導体とのリガンドフリー鈴木-宮浦カップリング反応(図 1)は困難であり、通常の加熱条件でも、既存のマイクロ波装置利用条件でも、進行しない。このような状況下、我々はマイクロ波の加熱効果／非加熱効果を切り分けた新しい概念の連続照射マイクロウェーブ装置を利用すると、当該反応が収率良く進行することを見いだした(図 2)。

【参考文献】

1. “Sulfur Modification of Au via Treatment with Piranha Solution Provides Low-Pd Releasing and Recyclable Pd Material, SAPd” Naoyuki Hoshiya, Masahiko Shimoda, Hideki Yoshikawa, Yoshiyuki Yamashita, Satoshi Shuto, Mitsuhiro Arisawa, *J. Am. Chem. Soc.* **2010**, *132*, 7270-7272. [Highlighted in *SYNFACTS 2010*, 1080.]
2. “Suzuki-Miyaura cross-coupling reactions using a low-leaching and highly recyclable gold-supported palladium material and two types of microwave equipments” Mohammad Al-Amin, Masayoshi Akimoto, Tsuyoshi Tameno, Yuuta Ohki, Naoyuki Takahashi, Naoyuki Hoshiya, Satoshi Shuto, Mitsuhiro Arisawa, *Green Chem.* **2013**, *15*, 1142-1145.
3. “Ligand-free Suzuki-Miyaura Coupling with Sulfur-modified Gold-supported Palladium in the Synthesis of a Conformationally-Restricted Cyclopropane Compound Library with Three-Dimensional Diversity” Mitsuhiro Arisawa, Takatoshi Sato, Naoyuki Hoshiya, Mohammad Al-Amin, Yuji Kogami, Satoshi Shuto, *ACS Combi. Sci.* **2014**, *16*, 215-220.
4. “Palladium-Nanoparticle-Catalyzed 1,7-Palladium Migration Involving C-H Activation, Followed by Intramolecular Amination: Regioselective Synthesis of N1-Arylbenzotriazoles and an Evaluation of Their Inhibitory Activity Towards Indoleamine 2,3-Dioxygenase” Koji Takagi, Mohammad Al-Amin, Naoyuki Hoshiya, Johan Wouters, Hiroshi Sugimoto, Yoshitsugu Shiro, Hayato Fukuda, Satoshi Shuto, Mitsuhiro Arisawa, *J. Org. Chem.* **2014**, *79*, 6366-6371. [Highlighted in *SYNFACTS 2014*, 1144.]
5. “Redox Switching of Orthoquinone-Containing Aromatic Compounds using Gas Energy” Kazuki Urakawa, Michinori Sumimoto, Mitsuhiro Arisawa, Masaki Matsuda, Hayato Ishikawa, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2016**, *55*, 7432-7436.
6. “Ligand-Free Suzuki-Miyaura Coupling Using Ruthenium(0) Nanoparticles and a Continuously Irradiating Microwave System” Toshiki Akiyama, Takahisa Taniguchi, Nozomi Saito, Ryohei Doi, Tetsuo Honma, Yusuke Tamemori, Yuuta Ohki, Naoyuki Takahashi, Hiromichi Fujioka, Yoshihiro Sato, Mitsuhiro Arisawa, *Green Chem.* **2017**, *19*, 3357-3369.

【講師略歴】

1994年	千葉大学薬学部卒業
1996年	千葉大学大学院薬学研究科博士前期課程修了
1999年	大阪大学大学院薬学研究科博士後期課程修了
1999年	千葉大学薬学部助手
2001年	千葉大学大学院薬学研究院助手
2002年	米国ハーバード大学化学科文部科学省在外研究員(兼任)
2005年	北海道大学大学院薬学研究科助教授
2006年	北海道大学大学院薬学研究院助教授(配置換)
2007年	北海道大学大学院薬学研究院准教授(配置換)
2013年	大阪大学大学院薬学研究科准教授(現在に至る)

【受賞歴】

2002年	有機合成化学協会 武田薬品工業研究企画賞
2004年	有機合成化学協会 三井化学研究企画賞
2006年	日本薬学会 奨励賞
2011年	田中貴金属ホールディングス MMS 賞
2014年	大阪大学 総長奨励賞
2015年	大阪大学 総長奨励賞
2017年	日本薬学会 学術振興賞
2017年	大阪大学賞

◇ 著作権法に基づき、講演の映像・音声、ならびに講演要旨は、ブログ・SNS への掲載等へ、複製または転用するなど、二次利用することを禁じます。