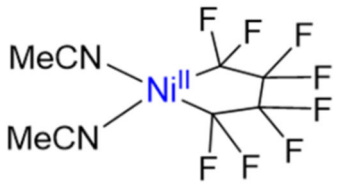
OIST | Innovation

汎用性と選択性に優れたフルオロアルキル化触媒

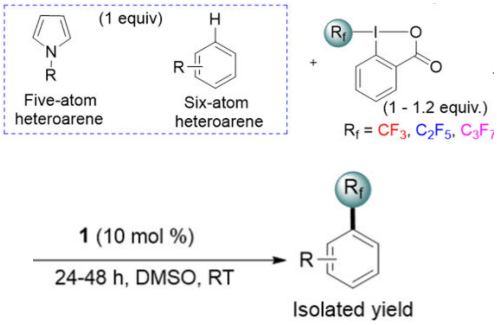
概要

複素環のフッ素化は、医薬用化合物や中間体などの化学中間体やタンパク質を選択的に修飾するために広く使われている手法です。現在のフルオロアルキル化触媒は、高価な金属／配位子を含むことが多く、高額な試薬に依存しているため、事実上反応はトリフルオロメチル化のみに限定されている状況です。また、安価なニッケルを用いた手法には、導入するフッ素化基ごとにニッケル触媒を調整する必要があるという大きな欠点があります。

ユージーン・ハサキン博士率いるOISTの研究チームは、単一の触媒を用いて、任意のペルフルオロアルキル基で複素芳香環を官能基化する新しいプラットフォームを開発しました。この触媒は非常に安定で、フッ素化反応はさまざまな溶媒中、穏やかな条件下で行うことができます。この新しいアプローチは、最適な化学的および生物学的特性を得るための、事実上無制限のフルオロアルキル化の選択肢への扉を開くものです。



ニッケル触媒1を用いて事実上任意のフルオロアルキル基を導入することが可能



5員および6員の複素芳香環を温和な反応条件下で容易に官能基化

技術のポイント

この単純なNi^{II}触媒は、例えばTogni試薬などの外部フルオロアルキル基質の存在下で、高原子価のNi^{III}/Ni^{IV}種へのアクセスを可能にする、シクロメタル化環状フルオロカーボンによって特徴づけられます。環状フルオロカーボンは金属部分で開裂することなく、目的のフルオロアルキル基質のみが ・C_nF_{2n+1} ラジカルとして遊離するため、あらゆるフルオロアルキル基に有効な万能触媒となります。この反応は、通常のルイス塩基溶媒中、室温で行うことができます。フルオロアルキル化はヘテロ原子に対して1位に選択的で、単一の生成物が得られます。この触媒は、ペプチドやタンパク質を複素芳香環含有アミノ酸において選択的にフッ素化するのにも使用できます。

応用

- フルオロアルキル化
- タンパク質の機能化
- 医薬品および機能性化合物の開発

利点

- 単一の触媒で様々なフルオロアルキル官能基をスクリーニング可能
- 安価
- 穏やかな反応条件

カテゴリー	代表研究者	知的財産
化学 & 材料科学	ハサキン・ユージーン 博士	特許出願中

問い合わせ先：

沖縄科学技術大学院大学　技術移転セクション　tls@oist.jp または 098-966-8937