

研究区分	教員特別研究推進 地域振興
------	---------------

研究テーマ	医薬品合成効率化に向けたフロー型マイクロ波システムの利用				
研究組織	代表者	所属・職名	薬学部・准教授	氏名	江上 寛通
	研究分担者	所属・職名	薬学部・教授	氏名	濱島 義隆
		所属・職名	薬学部・助教	氏名	山下 賢二
		所属・職名	静岡大学工学部・教授	氏名	間瀬 暢之
		所属・職名	静岡大学工学部・准教授	氏名	武田 和宏
		所属・職名	岐阜薬科大学・教授	氏名	佐治木 弘尚
		所属・職名	独立行政法人産業技術総合研究所・主任研究員	氏名	杉山 順一
		所属・職名	独立行政法人産業技術総合研究所・主任研究員	氏名	則包 恭央
		所属・職名	サイダ FDS・研究員	氏名	吉村 武朗
		所属・職名	サイダ FDS・研究員	氏名	大根田 訓之
発表者	所属・職名	薬学部・准教授	氏名	江上 寛通	

講演題目
マイクロ波による Arbuzov 反応および Wittig 反応の迅速化に関する研究
研究の目的、成果及び今後の展望
<p>有機合成において“加熱”は、目的の反応を進行させるために行う最も基本的な操作であり、その“加熱”を行う有効な手段の一つとして、マイクロ波が注目されている。マイクロ波による加熱では分子そのものの振動を利用するため、オイルバスなどを用いる外熱法に対して直接的かつ効率的に内部から加熱することができる。このためマイクロ波特有の急速加熱や選択的なエネルギー吸収が可能となり、外熱法では長時間要する反応の短時間化も期待され、プロセス化学の側面から強い関心がもたれる。そのため我々の研究グループでは様々な有機合成反応にマイクロ波化学を適応することで、その基礎基盤の構築とオンデマンド合成を指向したフロー型マイクロ波照射装置によるスケールアップ研究に関する知見を積み重ねてきた。</p> <p>本年度は 5-HT₂ ブロッカーである塩酸サルポグレラートの中間体合成の迅速化を目標に研究を遂行した。原料である 1-(chloromethyl)-3-methoxybenzene の Arbuzov 反応とそれに続く Wittig 反応は、外熱法で行った場合それぞれ約半日の反応時間が必要であることが報告されている。そこで、これらの反応のマイクロ波による加速効果についてバッチ型マイクロ波照射装置を用いて調査した。いくつかの検討の結果、マイクロ波加熱を用いることで Arbuzov 反応は 30 分で、Wittig 反応は 10 分で定量的に反応が進行することを見出した。劇的に反応時間を短縮することに成功したので、本系をフロー型装置に組み込むことで kg スケールの物質生産に応用するため、より適切な条件を精査中である。</p>