

研究課題別事後評価結果

1. 研究課題名： フッ素化合物の触媒的不斉炭素-炭素結合生成技術の開発と工業化

2. 研究代表者： 三上 幸一（東京工業大学物質理工学院 教授）

共同研究者： 網井 秀樹（群馬大学大学院理工学府 教授）

柴田 哲男（名古屋工業大学大学院工学研究科 教授）

3. 事後評価結果

○評点:

A 期待通りの成果が得られている

○総合評価コメント:

本研究課題では、新規医薬・材料開発に必要なフッ素化合物の触媒的不斉合成を、新規不斉炭素-炭素結合生成（CCF）反応を基盤に達成し、工業的製造への展開を目的としている。

研究代表者グループは、副課題「革新的CCF法の開発と工業化への展開」のもと、新しい触媒的CCF反応の開発を基盤に、工業化への展開を視野に入れた有機フッ素化合物の実用的合成法の開発に取り組んだ。その結果、ジカチオン性キラルPd触媒による不斉トリフルオロピルベート-エン反応、触媒的不斉エン反応、オキセテン合成反応、3成分クロスカップリング反応や、フルオロホルム等を用いたLi-enolate、芳香環(sp²)、アセチレン末端(sp)のジフルオロメチル化などに成功した。また、空気中で安定なトリフルオロメチル亜鉛反応剤を開発し、クロスカップリング反応に展開した。さらに、本成果に基づく含フッ素医薬品合成が製薬企業で試行されるなど、概ね当初の計画通りに研究は進捗した。

共同研究者グループは、副課題「フッ素化合物の先駆的分子変換法の開発と不斉触媒合成への展開」のもと、連携しつつ有機フッ素化合物の不斉合成技術開発の研究を実施した。その結果、トリフルオロメチル化、フルオロアルキル化、フルオロアリール化、炭素-フッ素結合活性化などを、求核性、求電子性、ラジカル反応に展開し、不斉合成も達成した。また、工業化に向けた手法としては、フルオロホルムの利用法の開拓を試み、トリフルオロメチル化およびジフルオロメチル化法を見いだした。本グループは世界でもあまり類のない、レベルの高い成果を上げた。特に、フルオロホルムの炭素-水素活性化のための塩基開発をはじめ、数種の反応剤は市販されるに至るなど、その成果は特筆に値する。

以上を総合すると、研究課題全体として、期待通りの成果が得られていると評価できる。研究代表者ならびに共同研究者は、我が国でも有数なフッ素化学研究のリーダー的存在であり、今後各々の研究を一層発展させるとともに、産業界との連携をより密にして、工業化への展開を遂行していただきたい。