【課題管理番号 16ak0101056h0001】

平成 29 年 05 月 29 日

平成 28 年度 委託研究開発成果報告書

I. 基本情報

事 業 名: (日本語) 創薬基盤推進研究事業

(英語) Research on Development of New Drugs

研究開発課題名: (日本語) 技術供与のため、光フローハロゲン化技術の高度化実用化を目指した研

究

(英語) Research on advanced and practical continuous-flow photochemical

halogenation technology

研究開発担当者 (日本語)富山化学工業株式会社 生産技術部 部長 毛利 勝

所属 役職 氏名: (英 語) Masaru Mori

General Manager

Industrial Technology Department, TOYMA CHEMICAL CO., LTD.

実 施 期 間: 平成 28年 11月 1日 ~ 平成 29年 3月 31日

分担研究 (日本語) 収率を最大化する光フロー反応条件の確立

スケールアップファクターの明確化及び工業用反応装置の開発

開発課題名: 英語 Establishment of reaction conditions in continuous-flow photochemical

halogenation, Clarification of scale-up factor and development of a

novel flow reactor for commercial production

研究開発分担者 (日本語) 石原 健太郎

所属 役職 氏名: (英 語) Kentaro Ishihara

Advisory Manager

Industrial Technology Department, TOYMA CHEMICAL CO., LTD

II. 成果の概要(総括研究報告)

光フローハロゲン化合成技術を用いて高品質、省エネルギー及び廃棄物低減を同時に実現することを目的とし、医薬品中間体として重要、且つ汎用なハロゲンメチルアリール誘導体の効率的製造法を確立した。

本反応技術は、フロー合成装置に原料とハロゲン化剤を流通させ、外部から光を照射する反応系であり、反応液全体に光を均一照射することで反応効率の飛躍的な向上を狙った技術である。当社において本方法による反応テスト系をラボで製作し、メチルアリール誘導体の臭素化における効果を検証した結果、反応収率、反応選択性、反応時間のいずれ項目においても従来のバッチ式合成法と比較して良好な結果を得ることに成功した。また、将来的な工業化を見据え、低環境負荷であるLEDを光源とした反応器を開発し、ラボスケールから約300倍のスケールアップを実現した。

For the purpose of achieve high quality, energy saving and waste reduction in pharmaceutical manufacturing, we have established the versatile synthesis method for producing halogen-substituted aryl derivatives using continuous-flow photochemical reaction technology. This technology consists of flow synthesis and photochemical reaction, and is characterized by the dramatically improvement of halogenation efficiency using a uniform light irradiation. In our lab experiments, it was demonstrated that the bromination of methyl aryl derivatives with this methodology resulted in good yield and good selectivity in comparison with the conventional batch synthesis method. In addition, we developed a novel flow reactor using LED as light source for commercial production and achieved 300 times scale than lab scale.

III. 成果の外部への発表

- (1) 学会誌・雑誌等における論文一覧(国内誌 0件、国際誌 0件) なし
- (2) 学会・シンポジウム等におけるロ頭・ポスター発表 なし
- (3)「国民との科学・技術対話社会」に対する取り組みなし
- (4) 特許出願

特許出願番号の公開を希望しない