

光の力でリサイクルして キラルなスルホキシドをつくる！

東京理科大学 薬学部 薬学科

教授 高橋 秀依

Hideyo Takahashi

2019年10月31日

キーワード

1. 光

2. キラル

3. スルホキシド

熱エネルギーから**光**エネルギーへ

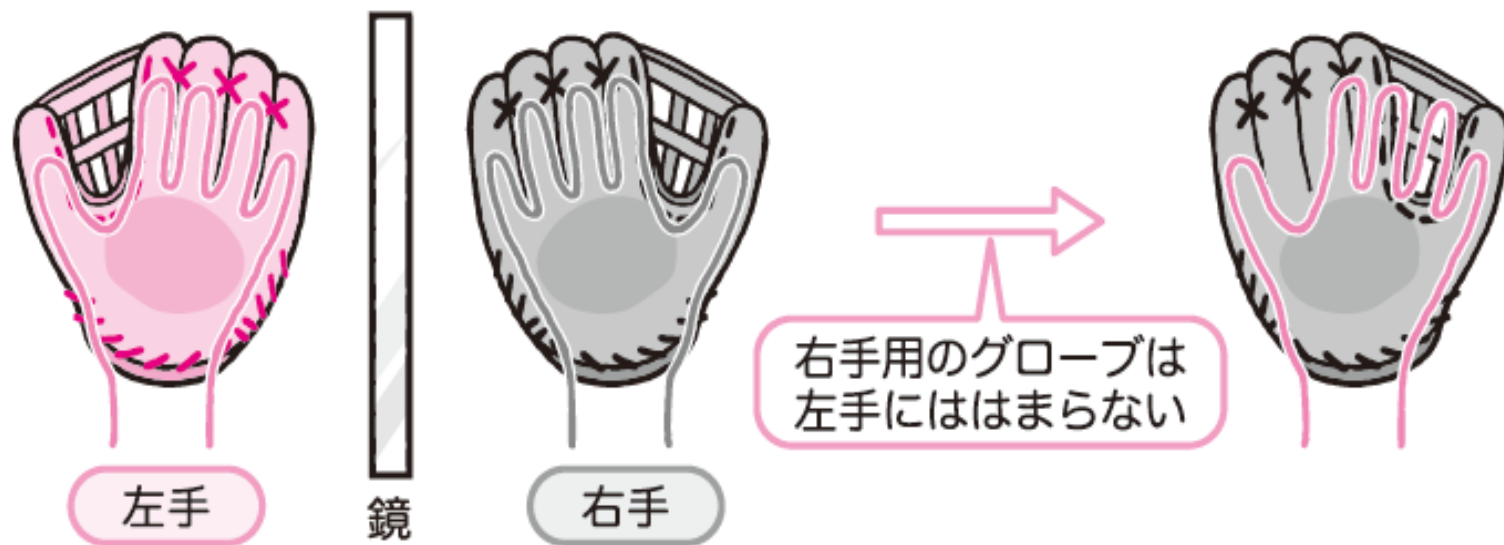


熱では反応しないモノが
光では簡単に反応する



光を使った新しい反応で
医薬品をつくる

世界はキラルであふれてる

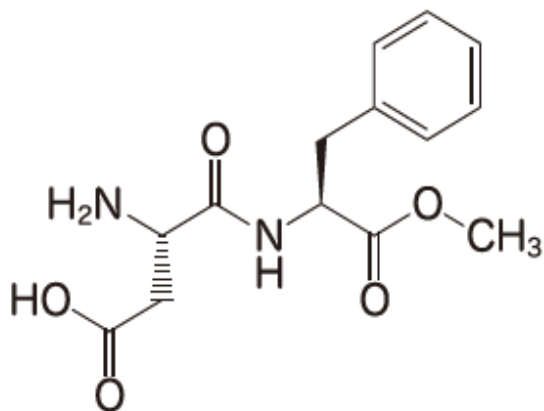


鏡に映った姿と元の姿は別のもの



キラル

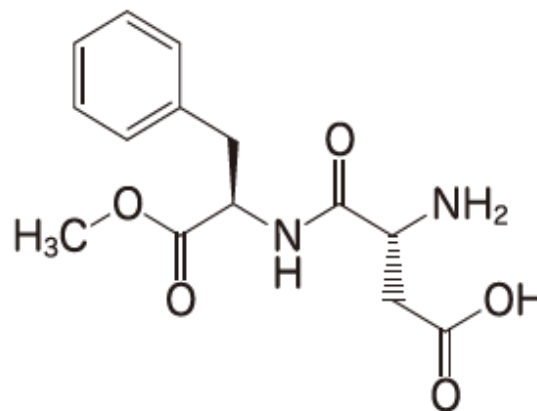
ヒトもキラル



(-)-アスパルテーム
人工甘味料



鏡

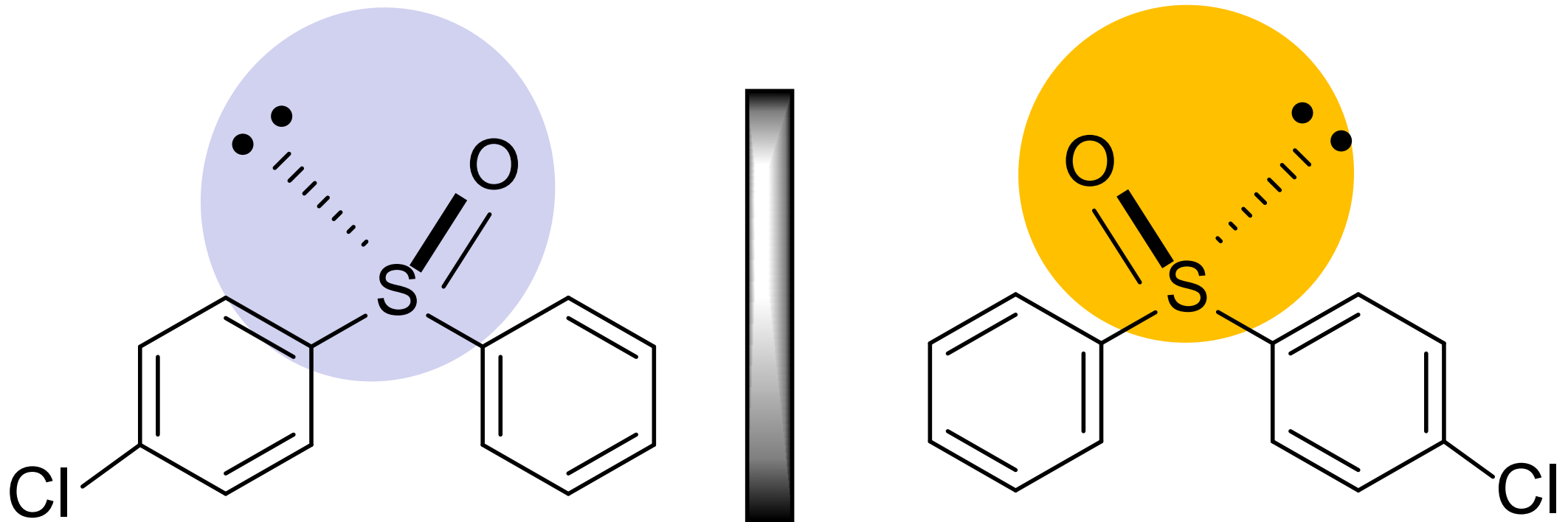


(+)-アスパルテーム
苦味

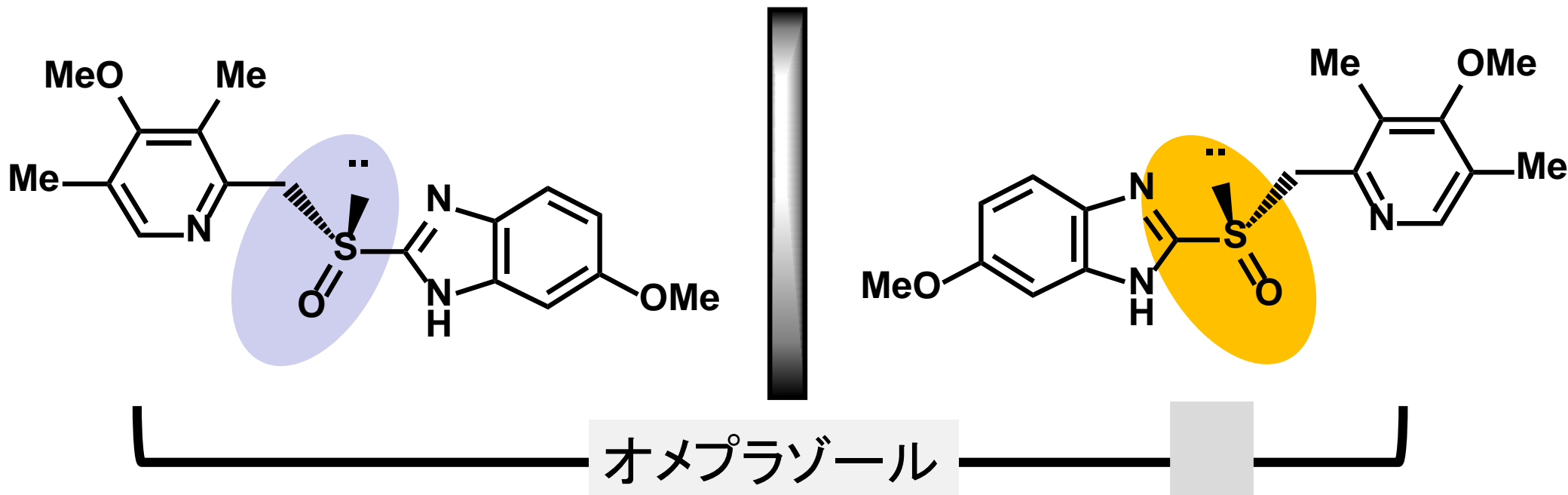


片方のキラルのみが効果を発揮する

スルホキシドもキラル



スルホキシドを持つ医薬品

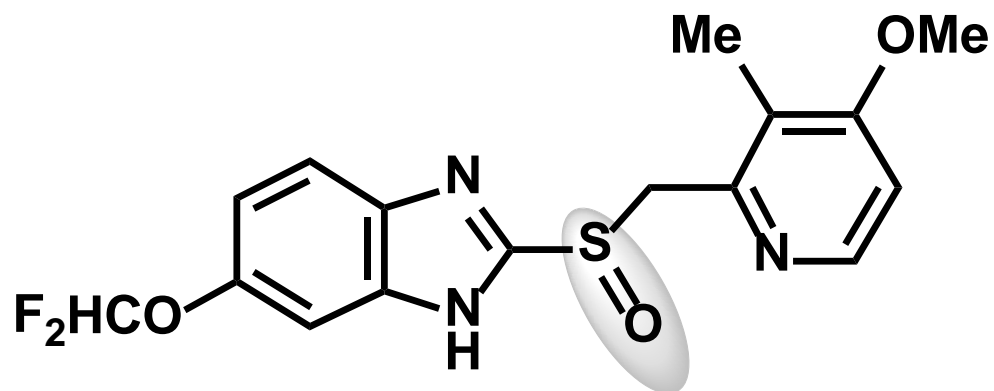


片方のキラルだけの方が効き目が良い
キラルスイッチ

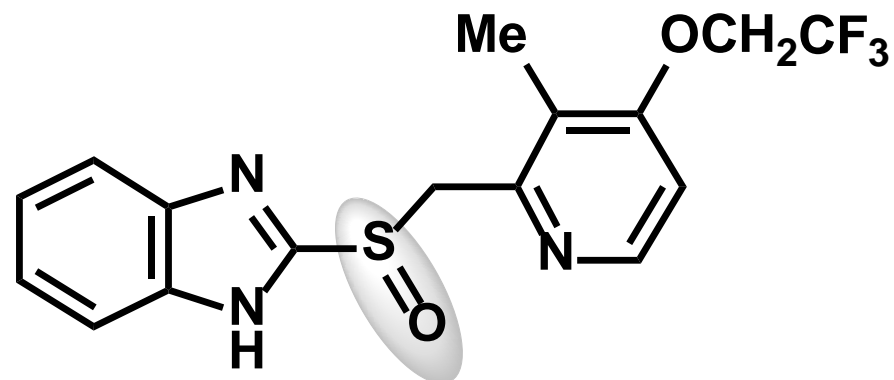
エソメプラゾール(ネキシウム®)

2017年国内売り上げ1019億円(第2位)

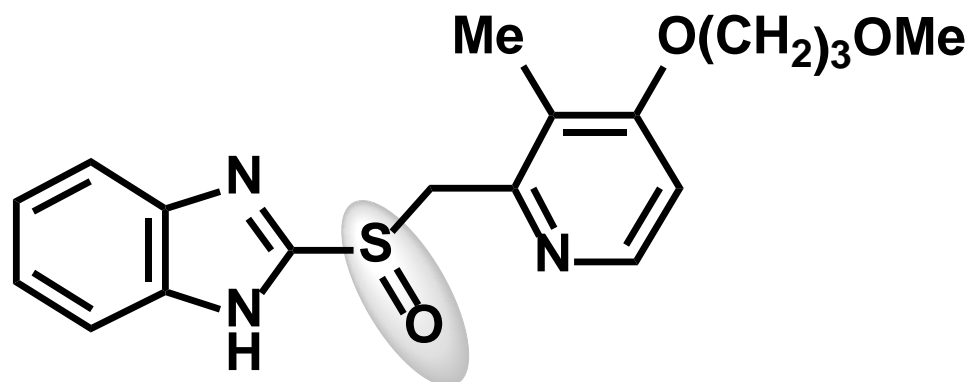
スルホキシドを持つ医薬品はたくさん！



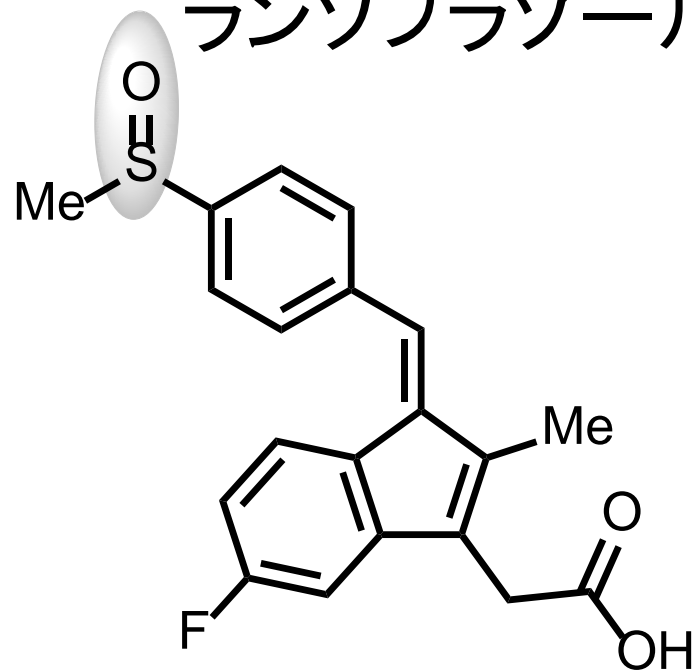
パントプラゾール



ランソプラゾール



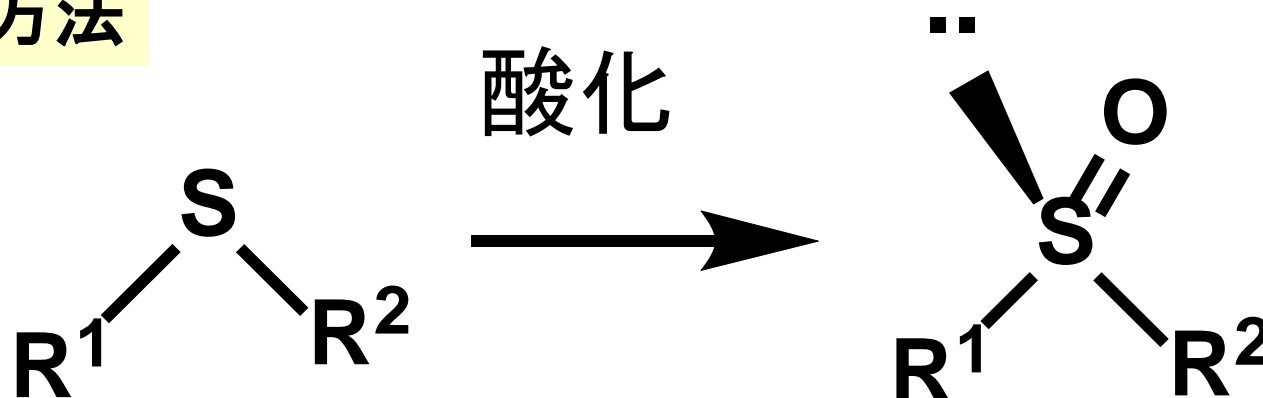
ラベプラゾール



スリンダク

キラルなスルホキシドをつくるには

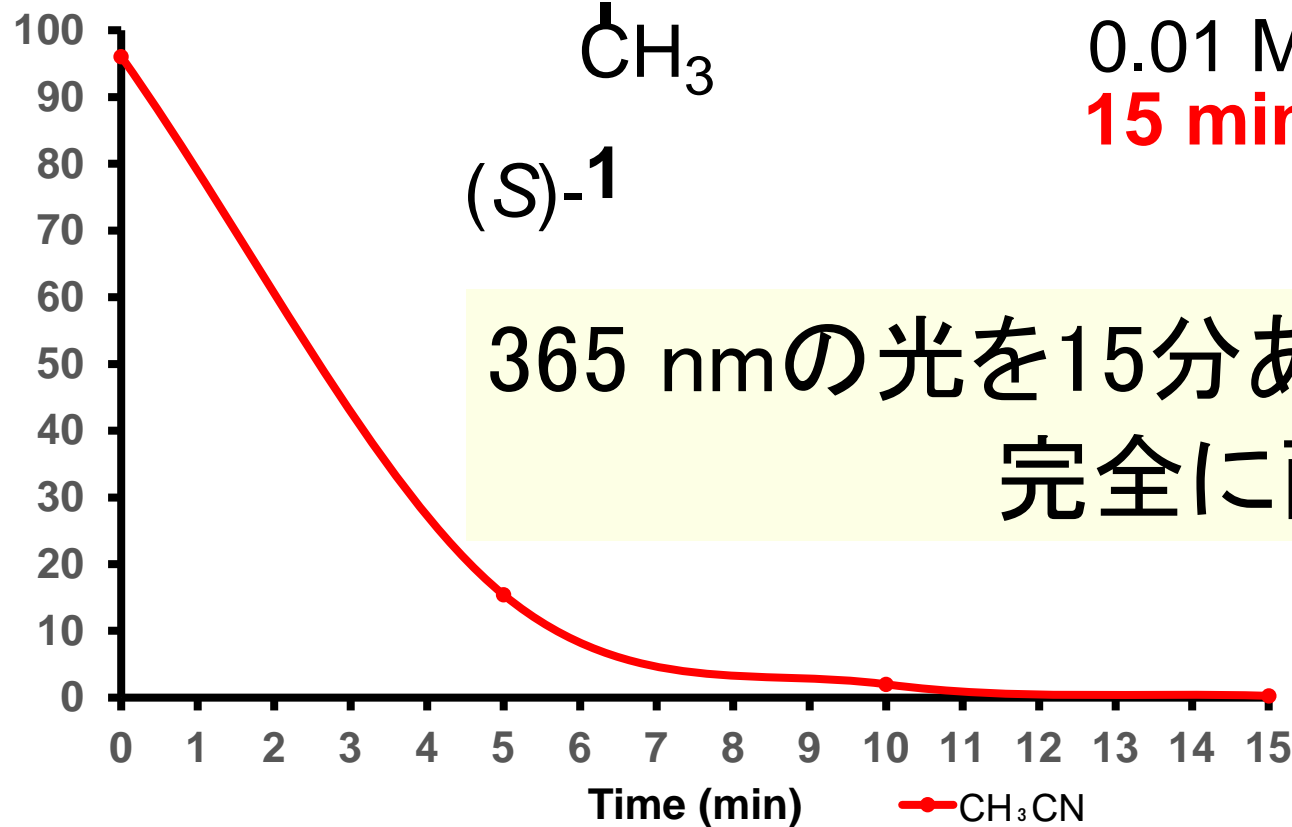
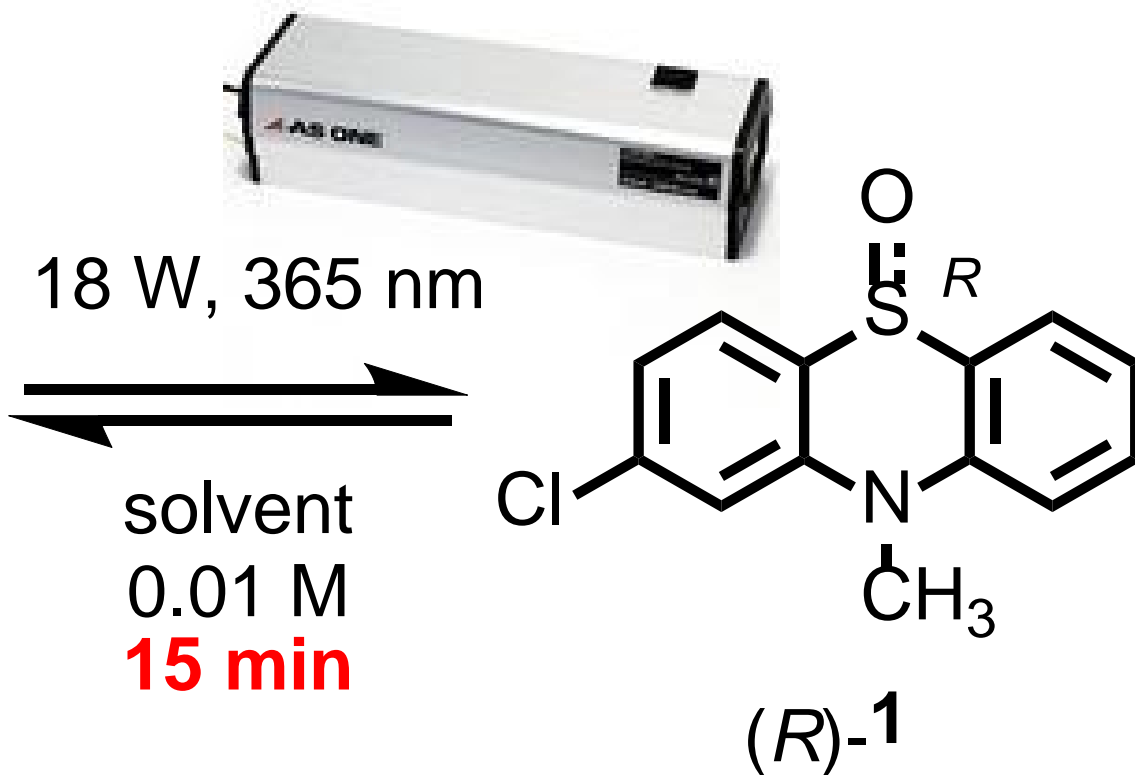
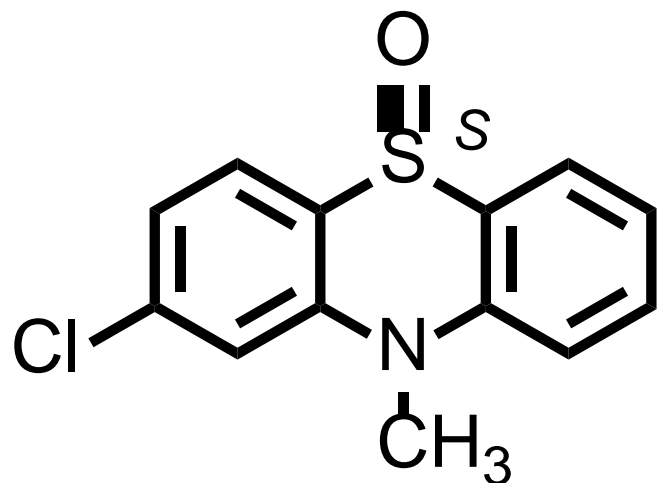
これまでの方法



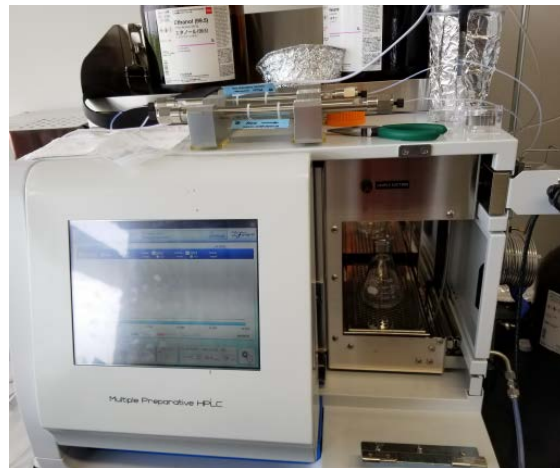
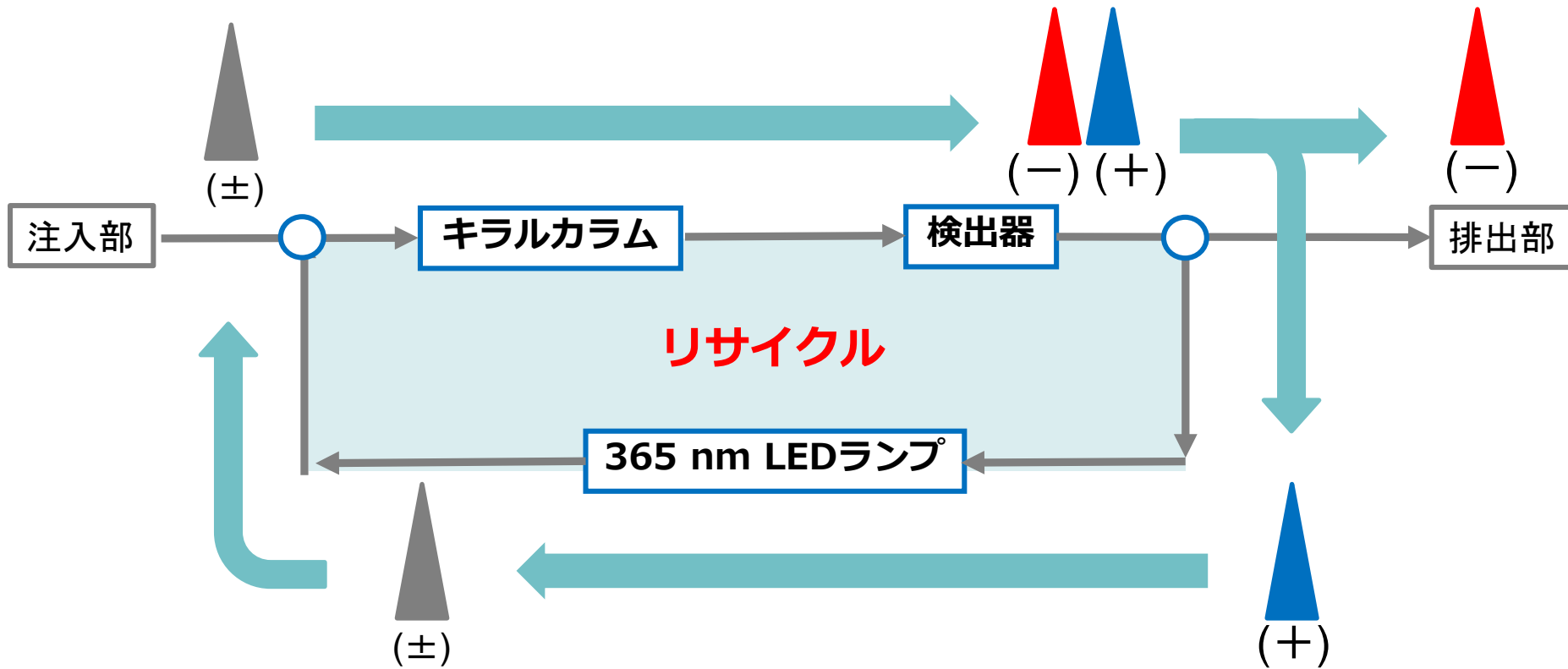
✖ 光学分割法：片方のキラルが無駄

✖ 媒的不斉反応：高価な不斉源が必要・効率悪い
反応系が複雑・精製が必要

光反応



リサイクルシステムを利用



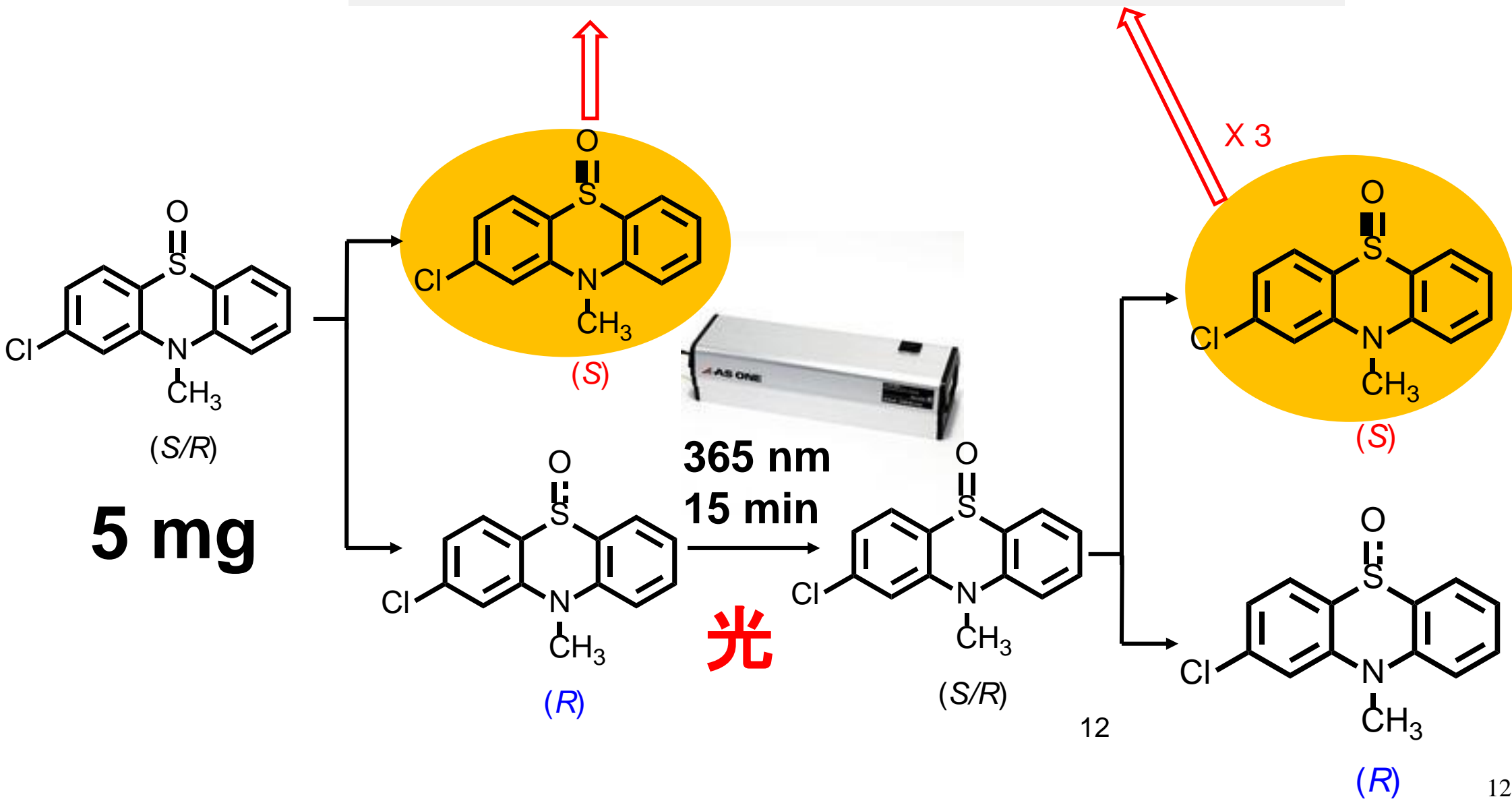
リサイクルHPLCの全体



ライト照射部

片方のキラルを増やすことに成功

4 cycle 4.3 mg, 96%ee



本技術の優位性

1. 片方のキラルをわざわざつくる必要ない

2. 必要なものは

キラルカラム リサイクルHPLC

そして **光**

3. 全てを片方のキラルだけにできる

まとめ

1. 光反応とリサイクルHPLC を組み合わせ、キラルなクロルプロマジンS-オキシドのみをほぼ定量的に得た。
2. オメプラゾールなど他のスルホキシドをもつ医薬品についても適用可能。

想定される用途

1. キラルなスルホキシドを有する医薬品製造
2. リサイクルHPLCの需要拡大
3. 他のキラルな医薬品製造への応用

実用化に向けた課題

1. それぞれに最適な波長など最適化検討
2. 光反応の速度をさらに向上させる条件検討
3. 他の医薬品へ適用できる一般性の確立

企業への期待

1. 大スケールで光反応を行う技術を持つ企業との技術開発を希望。
2. キラルな医薬品を開発中の企業との創薬研究を希望。
3. 分析分野への展開を考えている企業には、本技術の導入が有効と思われる。

本技術に関する知的財産権

- 発明の名称：スルホキシド化合物のエナンチオマー調製方法及びエナンチオマー調製システム
- 出願番号：特願2019-156444
- 出願人：学校法人東京理科大学
- 発明者：高橋 秀依、他2名(計3名)

産学連携の経歴

- 2018年-2019年
JSTA-STEP「機能検証フェーズ」に採択

お問い合わせ先

東京理科大学

研究戦略・産学連携センター 是成 幸子

TEL 03-5228-7431

FAX 03-5228-7442

e-mail ura@admin.tus.ac.jp