Soloshonok-Hamari Ligand

高収率・
高立体選択性

操作性
容易

リガンド
再利用可能

特殊設備
不要

低コスト

テーラーメイドアミノ酸TM
（非天然型α-アミノ酸）
合成のための先進的手法

浜理薬品工業株式会社

非天然型アミノ酸の高立体選択的合成技術

浜理薬品工業では、純粋な化学的手法による非天然型アミノ酸（特殊アミノ酸）の合成法を確立することを目指し、研究に取り組んでいます。我々の共同研究者である**Soloshonok**教授によって報告されたオリジナルの手法を改良し、新規に開発した**"Soloshonok-Hamari Ligand"**を用いて、様々な側鎖を有するアミノ酸を特殊な設備を用いることなく立体選択的に合成する方法の確立に成功しました。
本リガンドを用いる反応は、アミノ酸の立体反転反応や不斉付加反応などに幅広く用いることができ、より複雑な構造を持つアミノ酸合成にも応用可能です。また、本リガンドはリサイクルが可能でコスト面でも優位性があるため、大量スケールでの合成を行うことも可能です。
本技術は、思い通りのアミノ酸、**テーラーメイドアミノ酸™ 合成のための先進的手法**です。

本技術の利点

① 高収率・高立体選択性
新規に開発した"Soloshonok-Hamari Ligand"を用いる純粋な化学的手法によりアミノ酸の立体変換をおこなうため、酵素法や光学分割法と異なり、ほぼ定量的に高純度な光学活性アミノ酸が得られます。

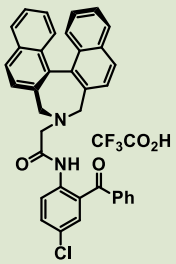
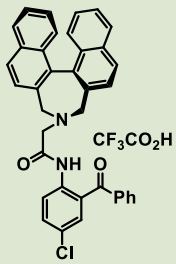
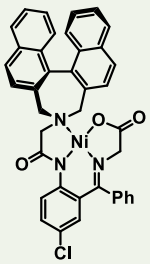
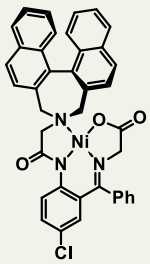
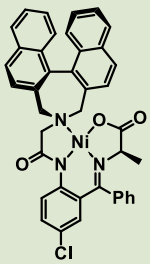
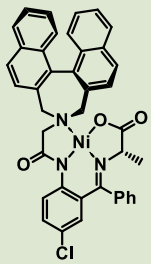
② 容易な操作性
本リガンドとアミノ酸とのSchiff塩基を配位子とするNi(II)錯体は、結晶性が高く安定であるため、ろ過などの簡便な操作により目的物を取り出すことができます。

③ リガンドの再利用が可能
反応に用いたリガンドは、アミノ酸単離の際に定量的に回収でき、リサイクルが可能です。

④ 特殊設備が不要
極低温装置やオートクレーブなどの特殊設備を必要とせず、一般的な研究機器・製造設備での非天然型アミノ酸合成が可能です。

⑤ 低コスト
上記の利点に加えて、目的とするアミノ酸にあわせてコスト面で優位性のある合成法を選択可能であり、キログラムスケールでの合成も可能です。非天然型である(*R*)型アミノ酸を(*S*)型アミノ酸と同程度の価格で合成可能である点も魅力です。

HAMARIが提供する"Soloshonok-Hamari Ligand"および本リガンドとグリシン・アラニンとのSchiff塩基を配位子とするNi(II)錯体

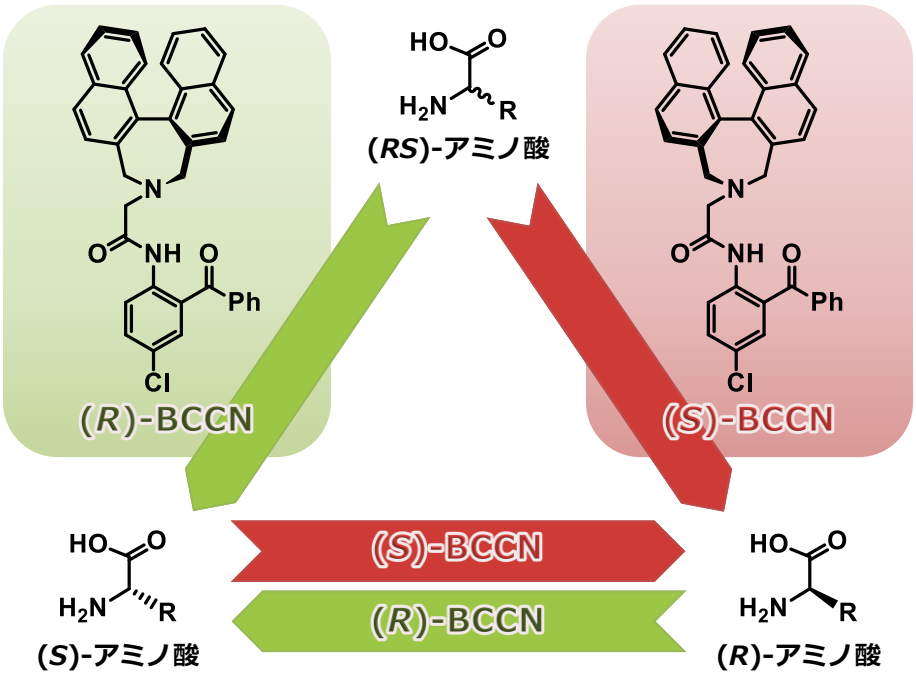
	アミノ酸*S*/*R*立体相互変換用		ジアステレオ選択的官能基導入用		α,α-二置換アミノ酸合成用	
						
	(*S*)-BCCN TFA salt	(*R*)-BCCN TFA salt	(*S*)-BCNG	(*R*)-BCNG	(*S*)-BCNA	(*R*)-BCNA
CAS #	1614264-49-1*	1614264-50-4*	1639014-40-6	1639014-43-9	1615217-87-2	1615217-89-4

* Free base

販売価格については弊社連絡先までお問い合わせ下さい。他のアミノ酸を有するNi(II)錯体合成のご依頼も承っております。0.5gよりご対応します。

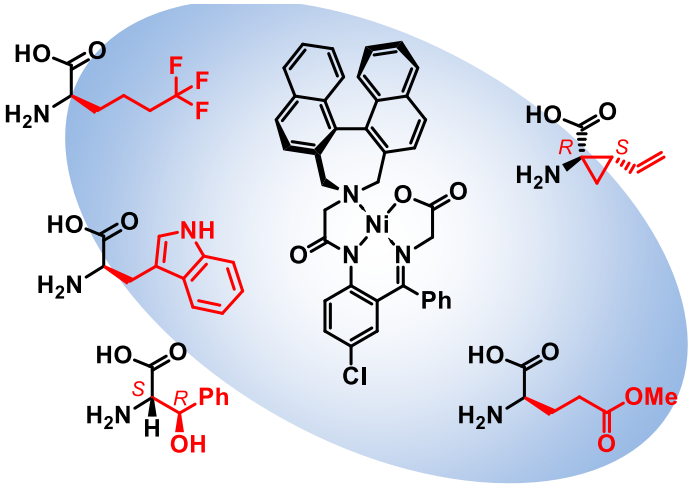
アミノ酸 *S*/*R* 立体相互変換

”Soloshonok-Hamari Ligands”を用いる反応により、工業生産される(*RS*)-アミノ酸をそれぞれの光学活性体へ変換することや、天然に存在する(*S*)-アミノ酸を、α位の立体化学相互変換によって**基礎研究や創薬分野において利用価値の高い(*R*)-アミノ酸へと立体配置を反転させる**ことが可能です。



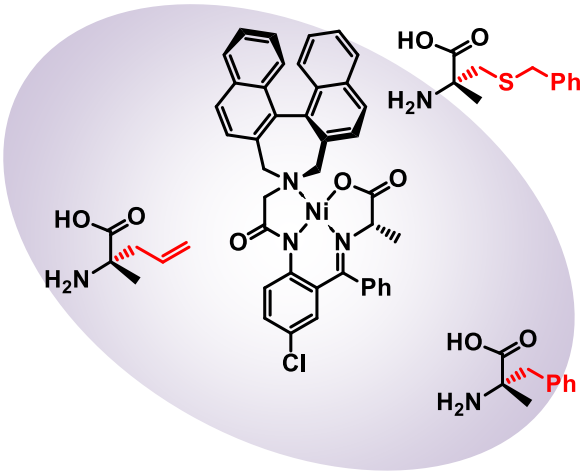
ジアステレオ選択的側鎖導入

本リガンドとグリシンとのSchiff塩基を配位子とするNi(II)錯体は、グリシン等価体として各種求電子剤との不斉反応に用いることができ、テーラーメイドアミノ酸™を合成可能です。また、アラニン-Ni(II)錯体はα-Me基を持つ光学活性α,α-二置換アミノ酸合成へ適用でき、**複雑な構造を持つアミノ酸への応用**も可能です。



アルキル化
アルドール反応

ジアルキル化
マイケル付加反応



アルキル化

研究活動実績

出願（日米欧等の主要国にて権利化済み）

軸不斉を有する*N*-(2-アシルアリール)-2-[5,7-ジヒドロ-6*H*-ジベンゾ[c,e]アゼピン-6-イル]
アセトアミド化合物及びそれを使用するα-アミノ酸のキラリティ変換方法
WO2014098063A1

軸不斉を有する*N*-(2-アシルアリール)-2-[5,7-ジヒドロ-6*H*-ジベンゾ[c,e]アゼピン-6-イル]
アセトアミド化合物とアミノ酸からなるキラル金属錯体を使用する光学活性α-アミノ酸の合成方法
WO2014188783A1

発表論文

Chemical Dynamic Kinetic Resolution and *S/R* Interconversion of Unprotected α-Amino Acids *Angew. Chem. Int. Ed.* **2014**, *53*, 12214–12217

Amino Acids **2020**, *52*, 1227–1261; *Eur. J. Med. Chem.* **2020**, *208*, 112736; *Chirality* **2020**, *32*, 1354–1360; *Org. Process Res. Dev.* **2020**, *24*, 294–300; *Org. Process Res. Dev.* **2019**, *23*, 629–634; *Org. Process Res. Dev.* **2019**, *23*, 619–628; *Symmetry* **2019**, *11*, 578–587; *Molecules* **2019**, *24*, 1828; *ChemistryOpen* **2019**, *8*, 701–704; *ACS Omega* **2019**, *4*, 11845–11851; *Molecules* **2019**, *24*, 4521; *ACS Omega* **2019**, *4*, 18942–18947; *ACS Omega* **2018**, *3*, 9729–9737; *Org. Biomol. Chem.* **2018**, *16*, 4968–4972; *Chirality* **2018**, *30*, 498–508; *Curr. Pharm. Des.* **2017**, *23*, 4493–4554; *Org. Biomol. Chem.* **2017**, *15*, 6978–6983; *Amino Acids* **2017**, *49*, 1487–1520; *Org. Process Res. Dev.* **2017**, *21*, 732–739; *Eur. J. Org. Chem.* **2017**, 1931–1939; *Eur. J. Org. Chem.* **2016**, 2757–2774; *Amino Acids* **2016**, *48*, 973–986; *Eur. J. Org. Chem.* **2016**, 999–1006; *J. Org. Chem.* **2015**, *80*, 9817–9830; *RSC Adv.* **2015**, *5*, 1051–1058; *J. Fluorine Chem.* **2015**, *171*, 67–72; *Org. Biomol. Chem.* **2014**, *12*, 6239–6249; *Adv. Synth. Catal.* **2014**, *356*, 2203–2208; *Amino Acids* **2014**, *46*, 2047–2073; *Amino Acids* **2014**, *46*, 945–952; *Beilstein J. Org. Chem.* **2014**, *10*, 442–448; *Amino Acids* **2013**, *45*, 1017–1033; *Amino Acids* **2013**, *45*, 691–718; *J. Fluorine Chem.* **2013**, *155*, 21–38; *J. Fluorine Chem.* **2013**, *152*, 114–118; *Org. Biomol. Chem.* **2013**, *11*, 4508–4515; *Org. Biomol. Chem.* **2013**, *11*, 4503–4507

共同研究者

ヴァディム・ソロショノク教授 (Prof. Dr. Vadim A. Soloshonok)

- Ikerbasque 特任教授
- バスク大学 (スペイン サン・セバスティアン) 在籍
- ウクライナ、イタリア、日本、米国そしてスペイン
  における25年以上にわたるアミノ酸の不斉合成研究実績
- 発表論文 350報以上；h-index: 83 (2021年3月時点)

本件に関するお問い合わせは下記まで

浜理薬品工業株式会社
営業開発部
〒541-0041 大阪市中央区北浜2-1-26 北浜松岡ビル6F
TEL 06-6205-7227 FAX 06-6205-7222
e-mail : toiawase@hamari.co.jp
https://www.hamarichemicals.com