

O-フルオロアルキルチオホスホン酸の合成

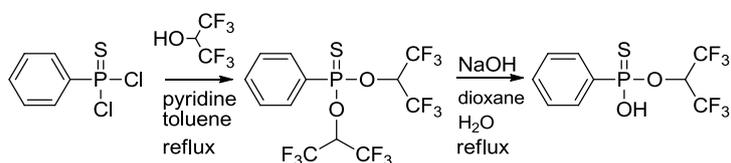
Synthesis of *O*-Fluoroalkyl thiophosphonic acid

1120069 山下 将司

Masashi Yamashita

医薬品の分野では、キラル化合物の両鏡像異性体の一方は薬理作用があるが、もう一方は副作用を示すことから、キラル化合物の光学純度を知ることは重要なことである。

目的とするチオホスホン酸は、官能基にキラル中心があり、相互作用部位とキラル中心がより近い位置にあることから対象化合物のキラリティを認識しやすく、さらに、フッ素があることで¹H, ³¹P, ¹⁹F NMRによる多種核のNMRで検出が可能となる。目的とするチオホスホン酸は、類似化合物の合成に要関する文献を基に、原料であるフェニルチオホスホン酸ジクロリドにヘキサフルオロプロパノールを加えてジエステルにし、水酸化ナトリウムで加水分解してラセミ体を合成した。その後、ブルシンにより光学分割し、光学活性な酸を得た。



この合成法と共に、シフト試薬の有用性の検証も併せて発表する。