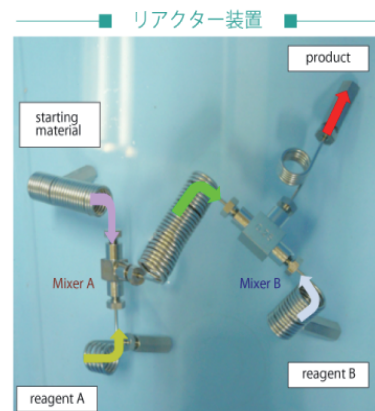
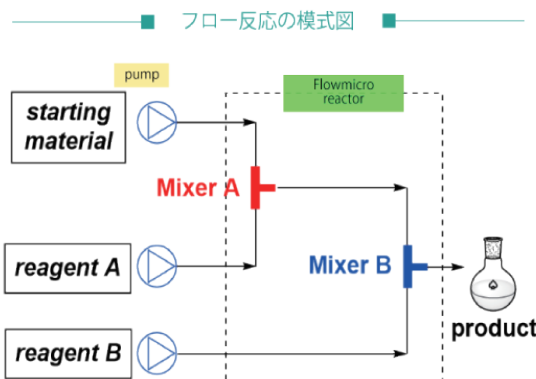


フローケミストリーを用いて開発初期から後期までの効率的な合成プロセスを確立し、プロジェクト全体の加速化、コスト削減に貢献します！

■フローケミストリーとは

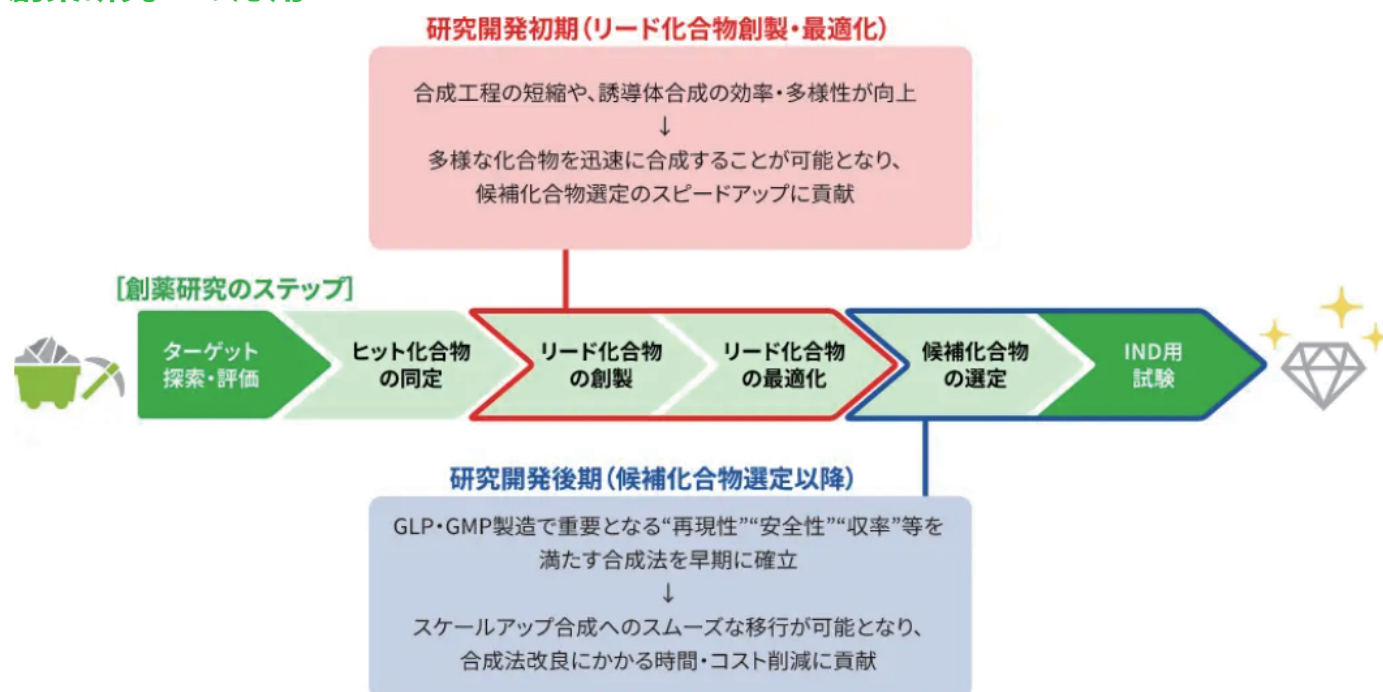
原料、試薬類の2種類以上の異なる溶液を微細流路に流し、温度や滞留時間（反応時間）をコントロールしながら化学合成を行う技術



【リアクターの特徴】

- ・リアクターの比表面積が大きく熱拡散が早い ⇒ 反応温度のコントロールが容易
- ・Mixer 間の長さ、流速で反応時間が決まる ⇒ 反応時間のコントロールが容易
- ・反応系内から生成物が随時流出される ⇒ 生成物の過剰反応を抑制し、収率が向上
- ・反応系が閉鎖系 ⇒ 高温、高圧下での反応や危険試薬・高活性物質の使用が可能
- ・送液量を増やすことでスケールアップが可能 ⇒ 小スペースでのスケールアップ合成が可能

■創薬研究への応用



Axcelead では、これまでにフラッシュケミストリーやニトロ化反応、光反応、パラレル合成、酸化反応などへの豊富な実用化実績がございます。

Medicinal Chemist と連携して、フローケミストリーの反応特性を活かしたユニークなオリジナルビルディングブロックをデザインし、リード化合物の創製・最適化研究・新規化合物ライブラリーの構築などに活用しています。

事例 1. フラッシュケミストリーへの応用

特長 1. 効率的で安全な合成法の確立

Original Route

【課題】

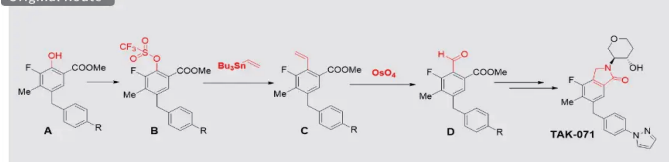
- ・反応制御のための構造変換の回数が多い
- ・有毒な金属を用いる反応が多い

Flow

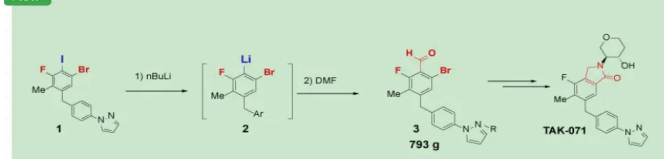
【改良結果】

- ・工程数を短縮し、合成にかかるコストを削減
- ・毒性の強い試薬の使用を回避し、安全性の高い合成法を確立

Original Route

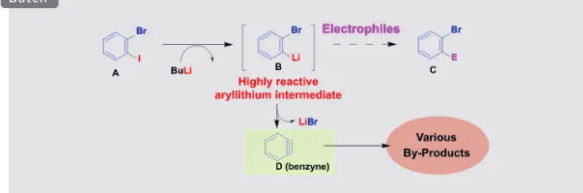


Flow



特長 2. 副生成物の抑制

Batch



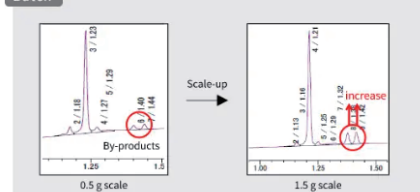
【課題】

オルト置換のハロゲン誘導体 A にバッチ法で BuLi を作用させると、不安定な中間体を経て、ベンザインが発生する。ベンザインは反応性が高く、様々な副生成物を生成してしまうため、数百 g レベルのスケールアップは困難であった。

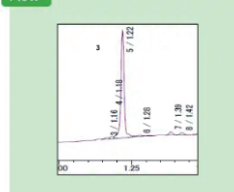
【改良結果】

フローケミストリーの活用により、110g のスケールアップにおいても副反応を抑制することに成功。反応収率の向上・生産性の向上を実現した。

Batch



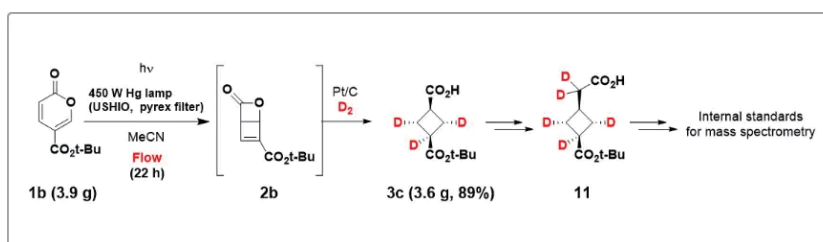
Flow



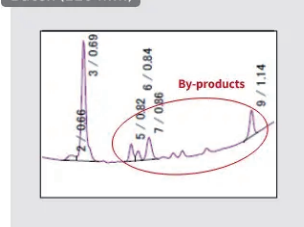
【出典】 Shotaro Miura et.al., Org.Biomol.Chem.,2019,17,8166

事例 2. 光反応への応用

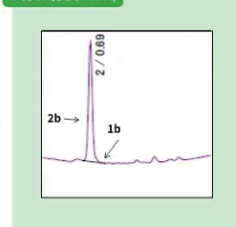
光フロー反応では、反応溶液に効率的に光を照射でき、また一定時間を経過した後の反応溶液は反応系外に出されるため、副反応の抑制が可能。ユニークなビルディングブロックを効率よく合成することに成功した。



Batch (120 min)



Flow (360 min)



中央に光源、周囲にガラス管の周りにチューブを巻いた装置、本装置では光源から反応店までの距離が一定に保てるので、効率的に光反応を進行させることができる。

【出典】 Toshiro Yamashita et.al., Tetrahedron.,2019,75,617-623