

不純物を含まない非ステロイド性抗炎症薬の製造

Development of Novel Methods for Preparing Chiral Non-Steroidal Anti-Inflammatory Drugs (NSAIDs)

研究者紹介

中田 健也 (総合理工学研究科物質化学領域・准教授)

Kenya Nakata (Associate Professor, Department of Chemistry)

概要

非ステロイド性抗炎症薬 (NSAIDs; Non-Steroidal Anti-Inflammatory Drugs) として知られる2-アリアルプロピオン酸類は、医薬品から市販薬まで広く汎用される薬剤のひとつです。

今回、われわれは独自に開発した不斉エステル化反応の技術を活用することで、安心・安全で不純物を含まないこれらの簡便な製造法の確立に成功したので紹介します。

An efficient protocol was developed to produce chiral 2-arylalkanoic acids, including non-steroidal anti-inflammatory drugs (NSAIDs) such as ibuprofen, ketoprofen, fenoprofen, flurbiprofen, and naproxen, and their esters in high yields from racemic carboxylic acids utilizing the asymmetric esterification.

特色 研究成果 今後の展望

不斉エステル化反応を用いる非ステロイド性抗炎症薬の合成

NSAIDs は (S) 体と (R) 体の二つの鏡像異性体が存在し、その多くは (S) 体が有効成分として働くことが知られています。例えば、その代表格のひとつであるイブプロフェンでは (R) 体は不活性であることが明らかとされています。また米国食品医薬品局

が、医薬品をラセミ体として製造するならば不要な鏡像異性体が完全に無害であることを証明することを義務づけるラセミックスイッチの指針を通達するなど単一の異性体のみを創製することが社会的にも求められています。

このような背景のもと、われわれは最近、新技術である不斉エステル化反応を見だしこれにより不純物を含まない NSAIDs の大量供給法の開発に成功しました。

(この成果は特筆すべき内容として学術誌の表紙を飾りました。)

(東京理科大学、椎名教授との共同研究)



キーワード

非ステロイド性抗炎症薬 (NSAIDs), イブプロフェン,
不斉エステル化反応, 速度論的光学分割

リンク

http://www.ipc.shimane-u.ac.jp/yuuki_lab/

<http://www.rs.kagu.tus.ac.jp/shiina/indexj.html>