

## 協会賞(技術的なもの)

江口 久雄氏 鯉江 泰行氏  
西山 正一氏 石川 真一氏  
曾我 真一氏



江口 久雄氏



鯉江 泰行氏



西山 正一氏

### (業績)「効率的クロスカップリング反応の開発と工業化」

クロスカップリング反応は、炭素-炭素(ヘテロ元素)結合形成反応として極めて重要であり、最近では、有機ファイン製品の合成技術としても注目されている。クロスカップリング反応は、通常、Pd触媒を用いて実施されるが、工業化に際しては、①塩化物原料が不活性、②製品中からの触媒成分の完全除去が困難等の課題があった。本研究は、上記課題を解決した「効率的クロスカップリング反応技術」に関するものである。主な業績は、以下の3反応技術に要約される。

#### 1. アリールアミノ化反応技術(Pd触媒法)の開発

次世代ディスプレイとして、有機ELディスプレイが注目されている。有機ELディスプレイには、正孔輸送材としてトリアリールアミン類が用いられるが、工業的に満足できる合成法がなかった。本研究では、Pd/P(*t*-Bu)<sub>3</sub>触媒存在下に、アリールハロゲン化合物とジアリールアミン化合物を反応させると、トリアリールアミン類が高収率で得られることを見出した。Pd/P(*t*-Bu)<sub>3</sub>触媒を用いるアミノ化反応は、極めて高活性であり、塩化物原料を用いた場合にも高収率で反応が進行する。東ソーグループでは、該アミノ化反応技術を用いて、多種のアリールアミン製品(有機EL材料、医薬中間体)の工業化を達成している。また、本研究の発見(1998年発表)が契機となり、学術研究分野においても、Pd/P(*t*-Bu)<sub>3</sub>触媒を利用する反応開発が急速に広まった。

#### 2. 鈴木-宮浦カップリング反応技術(Ni触媒法)の開発

最近、医薬品の金属許容濃度が強化され、Pd代替触媒のニーズが高まっている(欧州医薬品庁許容濃度: Pd=10 ppm, Ni=30 ppm, Fe=1,300 ppm)。こうした背景を受け、本研究では、鈴木-宮浦カップリング反応に有効なNi触媒法を開発した。触媒に、NiCl<sub>2</sub>(*t*meda)錯体を用いる該反応技術は、塩化物原料を用いた場合にも、高収率で反応が進行する。NiCl<sub>2</sub>(*t*meda)錯体は、調製が容易な安価触媒であり、反応後の洗浄操作で、触媒の完全除去が可能なることから、医薬品や液晶材料の工業化技術として極めて有用である。

#### 3. 熊田-玉尾カップリング反応技術(Fe触媒法)の開発

Fe触媒は、安価で安全(低毒性)であり、希少金属問



石川 真一氏



曾我 真一氏

題を解決する究極の触媒として期待される。本研究では、レジストモノマーの製造法として、Fe触媒を用いる熊田-玉尾カップリング反応を開発し、2000年に工業化した。これは、Fe触媒を用いるクロスカップリング反応の世界初の工業化例である。さらに本研究では、大学等との共同研究を通じて、Fe触媒を用いる反応開発にも積極的に取り組んでいる。開発したFe触媒反応は、いずれも塩化物原料に活性であり、反応後の洗浄操作で、触媒の完全除去が可能である。

本研究が開発した「効率的クロスカップリング反応技術」は、いずれも塩化物原料に活性であり、製品中への触媒混入の問題を解決している点が大きな特徴である。すでに、多種の有機ファイン製品(有機EL材料、液晶材料、レジスト材料、医薬中間体)の製造技術として採用されており、価値が高い。また、本研究は、塩化物原料の活性化や元素戦略を指向する学術研究分野にも大きな影響を与えており、有機合成化学協会賞(技術的なもの)に十分に値すると認められる。

【略歴】江口 久雄氏：昭和63年3月九州大学大学院総合理工学研究科修士課程修了

現在 東ソー・ファインケム(株) 事業企画室 室長

鯉江 泰行氏：昭和56年3月東京大学大学院工学研究科博士課程修了

現在 東ソー(株) 常務取締役

西山 正一氏：昭和62年3月関西学院大学大学院理学研究科修士課程修了

現在 東ソー(株) 南陽研究所 主任研究員

石川 真一氏：平成6年3月九州大学大学院総合理工学研究科修士課程修了

現在 東ソー(株) 南陽研究所 主任研究員

曾我 真一氏：平成2年3月富山大学大学院工学研究科修士課程修了

現在 東ソー有機化学(株) 主任研究員