

令和8年7月8日

各報道機関文教担当記者 様

弱い結合を残し、強い結合を選択的に切断する 新しい有機合成技術を開発

金沢大学医薬保健研究域薬学系の平野圭一教授、松本晃助教、王超准教授、大学院医薬保健学総合研究科創薬科学専攻博士前期課程2年の新井勇人、医薬保健学域薬学類5年の小倉駿佑、大学院医薬保健学総合研究科創薬科学専攻博士前期課程1年の鎌崎翔太の研究グループは、可視光を照射することで駆動する独自の触媒系を利用し、 α -シリルアルコール（※1）が持つ弱い炭素-ケイ素結合を残したまま、強固な炭素-水素結合を選択的に切断する分子変換技術を開発しました（図1）。

α -シリルアルコールは、炭素アニオン（※2）や炭素ラジカル（※3）といった活性種の前駆体として機能することから、医薬品の精密化学合成に利用される有機ケイ素化合物（※4）の重要な原料です。また近年では、有機ケイ素化合物そのものを医薬品へ応用する研究も進んでいます。しかし、その合成には多段階の反応を要し、官能基許容性（※5）にも乏しいことから、より簡便で汎用性の高い合成法の開発が求められてきました。

本研究では、通常は化学反応で優先的に切断されやすい α -シリルアルコールの炭素-ケイ素結合を残しつつ、より強固な炭素-水素結合だけを選択的に切断し、続く官能基導入へつなげることで、入手容易な単純構造の α -シリルアルコールを、より複雑で高機能な分子骨格へと「アップグレード」させることに成功しました。本技術は、「弱い結合を切る」という従来の分子変換の発想を覆す成果であり、有機ケイ素化合物の効率的な合成と活用の幅を大きく広げる新たな手法として、創薬や機能性材料開発への応用が期待されます。

本研究成果は、2026年7月2日8時(米国東部標準時)に米国化学会誌『*ACS Catalysis*』のオンライン版に掲載されました。

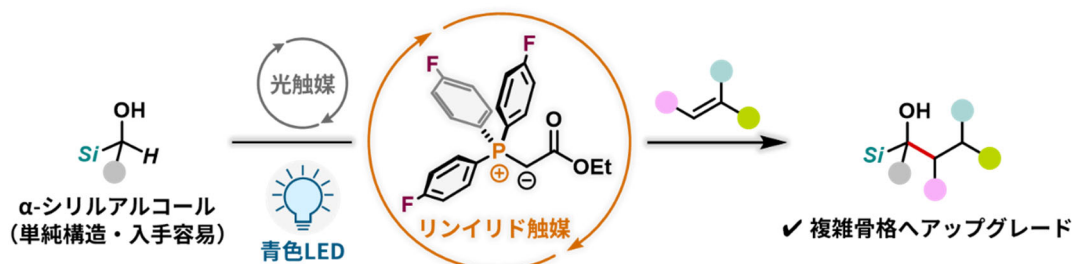


図1. 研究概要

【研究の背景】

周期表で炭素 (C) の真下に位置するケイ素 (Si) は、炭素と類似した性質を持ちつつも、その電気陰性度 (※6) や原子半径の違いによって、有機分子に炭素とは異なるユニークな物性や機能を付与することができます。このため、炭素-ケイ素 (C-Si) 結合を有する有機ケイ素化合物は、創薬や材料化学をはじめとする多様な研究分野で活用されています。

また、有機ケイ素化合物が示す特異な反応性は、ケイ素を含まない一般的な有機分子を合成する上でも極めて有用です。中でも、本研究で着目した α -シリルアルコールは、比較的弱い C-Si 結合の切断を足がかりとして高活性な炭素アニオンを発生させ、新たな化学結合を形成するための、強力な合成ツールとして利用されてきました (図 2)。さらに近年では、同様のアプローチによって炭素ラジカルと呼ばれる別の高活性種も発生可能であることが明らかとなり、有機合成化学の可能性を広げる分子として、大きな注目を集めています。

一方で、この有用な α -シリルアルコールを合成する方法には、大きな課題がありました。従来法では、非効率な合成経路による工程数の増加や、反応性の高い金属試薬などの使用が避けられず、合成可能な α -シリルアルコールの分子構造が大きく制限されていました。そのため、より簡便で汎用性が高く、さまざまな構造の α -シリルアルコールを自在に合成できる新しい手法の開発が強く望まれていました。

【研究成果の概要】

本研究グループは、ラジカル種に特有の反応過程である「水素原子移動 (※7)」に着目し、入手容易な α -シリルアルコールから、目的とする複雑な分子構造を直接変換する新たなアプローチの開発に取り組みました。具体的には、光触媒 (※8) の作用によって生じるラジカル種を利用して、 α -シリルアルコール中の特定の C-H 結合を切断し、新たな炭素-炭素結合を形成する反応を着想しました。

反応条件を精査した結果、本研究グループが先行研究で見いだしていたリンイリド (※9) 由来のラジカル種が、標的とする α -シリルアルコールの C-H 結合を効率的に切断することを明らかにしました。さらに、このラジカル種を水素原子移動触媒として活用することで、 α -シリルアルコールのアルキル化 (※10) 反応の開発に成功しました (図 3)。

本反応の特筆すべき点として、化学反応によって切断されやすい C-Si 結合を保持したまま、より強固な C-H 結合のみを選択的に切断できる点が挙げられます。加えて、リンイリドの柔軟な構造修飾性を活かして詳細な触媒構造のチューニングを行った結果、既存の水素原子移動触媒を大きく上回る反応性と選択性を示すリンイリド触媒を見いだすことができました。

本反応は、反応性の高い金属試薬などを一切必要とせず、可視光 (青色 LED) を照射するのみという極めて穏やかな条件下で進行します。これにより、従来法では合成が難しかった多様な官能基を有する複雑な α -シリルアルコールを、少ない工程数で効率よく合成することが可能となりました。さらに、本手法で得られた α -シリルアルコールは、反応条件を変えることで C-Si 結合および炭素-酸素 (C-O) 結合を選択的に変換できる

ことを実証しました。すなわち、本手法は目的分子の合成だけでなく、その後の多様な分子変換にも活用できる高い汎用性を備えており、これまで合成が難しかった有機ケイ素化合物へのアクセスを大幅に広げる成果です。

【今後の展開】

本研究により、これまで合成上の制約が大きかった α -シリルアルコールを効率的に供給できる新たな手法が実現されました。これにより、 α -シリルアルコールの有機合成化学における活用が促進されるものと期待されます。近年、 α -シリルアルコールをはじめとする有機ケイ素化合物を光触媒反応に利用する研究は精力的に行われていますが、これらは主に「弱い C-Si 結合の切断」を起点とする分子変換の開発を目的としていました。一方、本研究では、こうした固定観念に捉われず、C-Si 結合をあえて保持したまま進行する光触媒反応条件を確立した点で、先駆的な成果と言えます。本研究を契機として、「弱い結合を残し、強い結合を選択的に切る」合成戦略が拡充されることで、医薬品や農薬、機能性材料に用いられる複雑な有機分子の合成を、より少ない工程で効率よく合成できるようになると期待されます。

本研究は、日本学術振興会（JSPS）科学研究費助成事業「若手研究」（JP25K18028）、「基盤研究 B」（JP25K02385）、「挑戦的研究（萌芽）」（JP24K22017）、国立研究開発法人科学技術振興機構（JST）創発的研究支援事業（JPMJFR242B）、北陸銀行若手研究者助成金、公益社団法人 アステラス病態代謝研究会、公益社団法人 鈴木謙三記念医科学応用研究財団、公益社団法人 上原記念生命科学財団、公益社団法人 武田科学振興財団、公益社団法人 旭硝子財団、触媒科学計測共同研究拠点共同利用・共同研究（25AY0743）、文部科学省先端研究基盤共用促進事業（コアファシリティ構築支援プログラム）（JPMXS0440300025）、JSPS 地域中核・特色ある研究大学強化促進事業（JPJS00420230006）の支援を受けて実施されました。

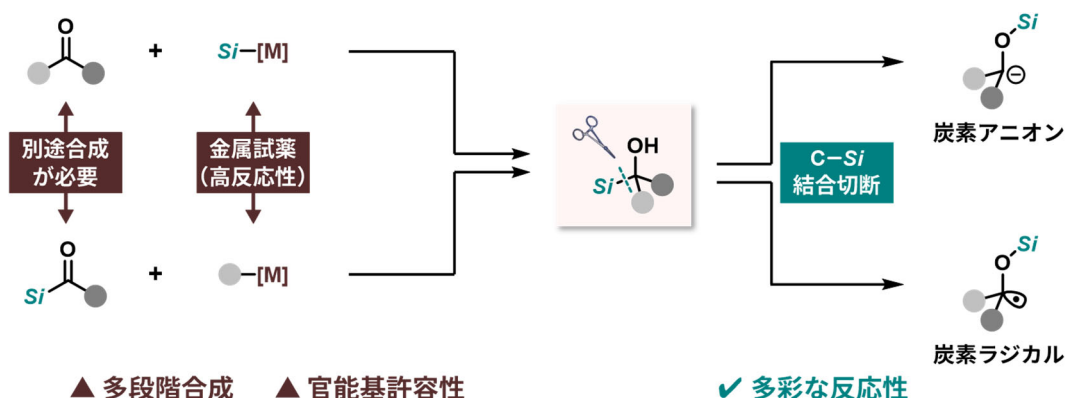


図 2. α -シリルアルコールの反応性と合成上の課題

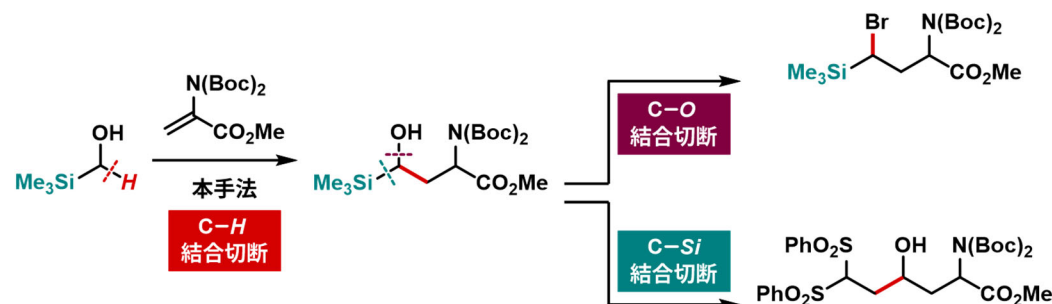
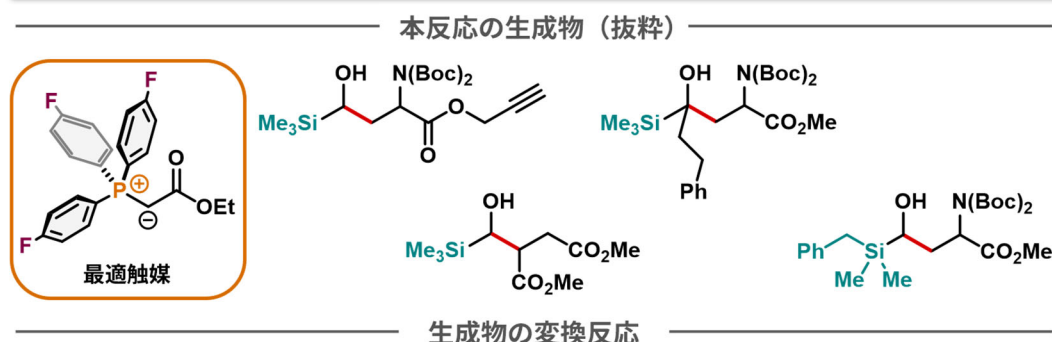
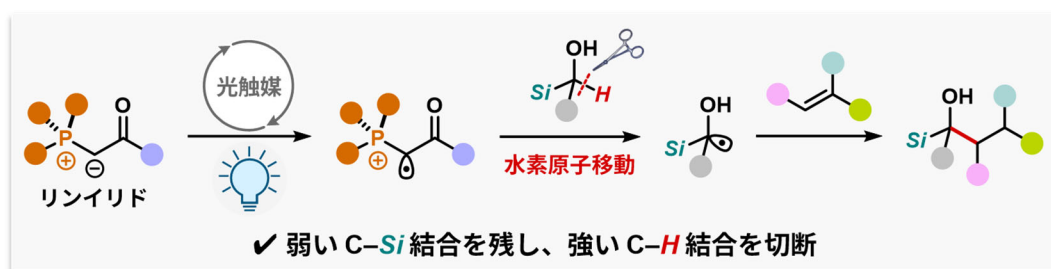


図 3. 本研究の成果

【掲載論文】

雑誌名 : *ACS Catalysis*

論文名 : α -C-H Alkylation of α -Silyl Alcohols: Hydrogen Atom Transfer Catalysis Preserving Labile C-Si Bonds

(α -シリルアルコールの α -C-H アルキル化 : 不安定な C-Si 結合を保持する水素原子移動触媒反応)

著者名 : Yuto Arai, Shunsuke Ogura, Shota Kamasaki, Chao Wang, Akira Matsumoto, Keiichi Hirano

(新井勇人、小倉駿佑、鎌崎翔太、王超、松本晃、平野圭一)

掲載日時 : 2026 年 7 月 2 日 8 時 (アメリカ東部標準時間) にオンライン版に掲載

DOI : 10.1021/acscatal.6c03020

【用語解説】

※1 α -シリルアルコール

同一炭素原子上にケイ素置換基およびヒドロキシル基を有する化合物。

※2 炭素アニオン

炭素原子上に負電荷を持つ化学種の総称。

※3 炭素ラジカル

炭素原子上に不対電子（ペアを組んでいない電子）を持つ化学種の総称。

※4 有機ケイ素化合物

分子内に炭素-ケイ素結合を含む有機化合物の総称。

※5 官能基許容性

化学反応によって目的の変換を進行させる際、分子内に存在する他の官能基が影響を受けずに耐えられるかの度合いを指す。有機合成反応を評価する重要な指標の一つ。

※6 電気陰性度

原子が電子を引き寄せる強さの相対的な尺度。炭素は 2.55、ケイ素は 1.90（ポーリングの値）。

※7 水素原子移動

ある原子に結合していた水素原子が別のラジカル種へと移動し、新たなラジカル種を生じる反応。

※8 光触媒

光（ここでは可視光）を吸収して電子やエネルギーの移動を可能にする触媒。

※9 リンイリド

正電荷を持つリン原子と負電荷を持つ炭素原子が隣り合った構造を持つ化合物。

※10 アルキル化

分子構造に炭素鎖を導入する反応。

【本件に関するお問い合わせ先】

■研究内容に関すること

金沢大学医薬保健研究域薬学系 教授

平野 圭一 (ひらの けいいち)

TEL : 076-234-4411

E-mail : k1hirano@p.kanazawa-u.ac.jp

■広報担当

金沢大学医薬保健系事務部薬学・がん研支援課企画総務係

松村 晃 (まつむら あきら)

TEL : 076-234-6858

E-mail : y-somu@adm.kanazawa-u.ac.jp