

## ——— コラム② トリホスゲンと保護試薬 ———

トリホスゲン ( $C_1_3CO_2C=O$ ) はご存知の通り常温下では固体であり、それ自体はホスゲンのように肺気腫を起こすことも無く、無毒である。しかしながら溶液中で溶解するとちょうどホスゲン  $COCl_2$  が3当量得られ、それによりトリホスゲンなるネーミングを得ている。したがって非常に実用的であり、ホスゲンガスのような大掛かりな設備を必要としなくても、条件さえ合えば通常の常温常圧の反応器を利用することで酸クロロ反応が可能となる。

ところで実は筆者は中国でトリホスゲンが2001年当時にすでに工業スケールで合成されていたことは知っていた、しかしながらその際具体的にどのような場面で使用されているかについては皆目見当がつかなかった、ところが偶然ながら今般の訪中時になんとこれが、保護アミノ酸製造には欠かせない、Diboc合成に使用されていることが分かった、また高品質のDibocが一般的な反応設備で合成されていることを知ったとき、これで業界の需給構造が変わるととっさに感じた。即ち従来の製法ではホスゲンを利用する特殊反応として特別の設備条件が必要であったものが、トリホスゲンを利用することで、通常の反応器によりDibocが合成できることになったのである。これによりDibocの合理的な価格による大量生産が可能となり、これが中国国産の保護アミノ酸生産を強力に後押ししているのである。

すでに述べたように保護アミノ酸の主要ソースは従来の欧州から着実に中国を中心とする、アジアに移ってきている。またそれと時を同じくして世界的にペプチドを含んだ創薬事業もここに来て伸張している。その中で今まで以上に保護アミノ酸の需要は増えるのではないかと認識している。今中国でDibocやFMOC、CBZなどの保護試薬が独自の合成方法で製造されつつあるなか、今後は単なる価格競争といった次元を脱して、各ステージごとに適切に必要な数量の保護アミノ酸を提供でききる仕組みづくりや、守秘義務の確保またその後の商品化におけるビルディングブロックの供給・合成など総合的なサービス提供がますます必要になると感じている。

いずれにせよ中国をペプチド事業の供給ソースとして見た場合、今やすべて必要な原材料が合理的コストで揃う国になったとって過言ではないと思う、それだけに後はどのように共存すべきかを的確に考え将来の事業化の推進の方向性を探って行きたい。またその意味でインドに拠点を置く弊社は日本の顧客が期待する高度な要求を的確に受け入れることができる可能性を最も保持している企業であると自負している。