



【研究内容】

医薬品合成を志向したキラル 1,2-ジアミン類の汎用的合成法の開発

【研究目的】

キラル 1,2-ジアミン類の多品種合成を可能とする、新規ジアミン類汎用的合成法の確立。

【今後の展開】

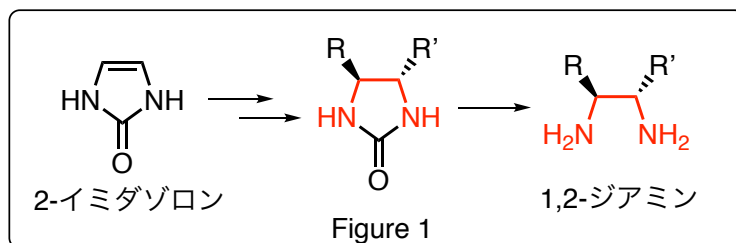
現在、我々の合成ルートにおける鍵反応の一つである、環状ウレア化合物の温和な開環反応の開発に着手しています。本反応開発後は、種々のキラル 1,2-ジアミン類の合成に適用し、ジアミン類多品種合成における我々の合成法の有用性を実証します。

【主な研究テーマ／実績テーマと内容】

キラル 1,2-ジアミン骨格は、ビオチン、リン酸オセルタミビル、オキサリプラチンなど、多くの生理活性物質や医薬品に含まれており、また、DPENを始めとした不斉配位子としても汎用されている、合成化学上極めて重要な骨格です。

しかし、その合成法においては出発物質と目的物質の構造が極めて類似している場合や、目的物の構造が決まっている場合など、限られた化合物に対しては有効な手法ばかりであり、医薬品の探索研究のような、多品種の化合物が必要な場合には適用が難しいものばかりでした。

一方で、これまで我々の研究グループは、単純複素五員環 2-イミダゾロンを出発物質としたキラル-*trans*-1,2-ジアミン合成手法 (Figure 1) を報告しています。(Tetrahedron Lett., 2001, 42, 6353., Heterocycles, 2014, 88, 1337., Heterocycles, 2015, 90, 874.)



本手法は種々のジアミン化合物を同一の出発原料

から合成できるという点、すなわち、汎用性という点で優れた手法に成り得るものですが、最終ステップにおいて、極めて安定な環状ウレア構造を開裂させるために、過酷な反応条件を要するという欠点がありました。

現在、上記の欠点を改善するため、環状ウレア構造の温和な開裂法の探索を行っています。

【企業との共同研究の実績】

なし