

【研究内容】

単純複素五員環を利用した高効率不斉合成プロセスの開拓と展開

【研究目的】

単純複素五員環である 2-オキサゾロン、2-イミダゾロンなどの二重結合部位の付加反応活性を利用して、

- (1) 医農薬品など各種生物活性物質類に内包されている光学活性 2-アミノアルコールや 1,2-ジアミン等の簡便かつ汎用性高いキラル合成法を開発する。
- (2) 既存のシステムでは実現困難であった、極めて高い反応活性とエナンチオ選択性を兼ね備えた汎用性高い不斉有機分子触媒を開発する。

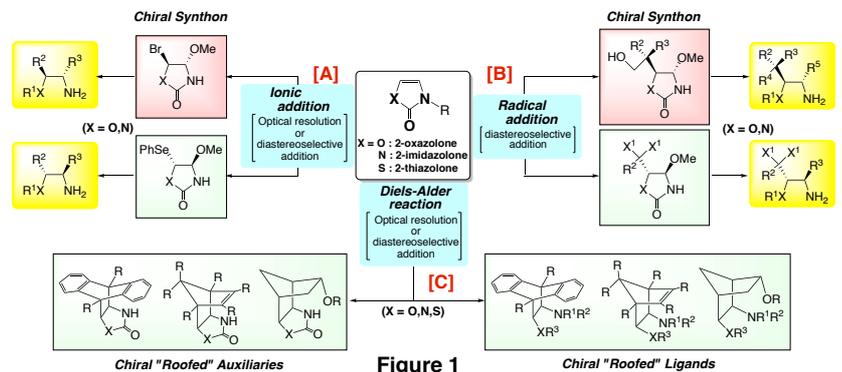
これら高効率不斉合成プロセスの開拓により、省資源・省エネルギー型社会の実現に薬学及び有機合成化学の観点から貢献することを目的とする。

【今後の展開】

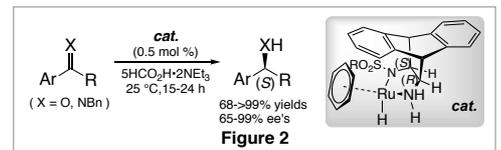
- (1) 2-アミノアルコール系及び 1,2-ジアミン系キラル合成子の、より簡便な合成手法の開発と、創薬を指向した各種光学活性化合物群の多品種簡便合成法の確立 (安山研究室との共同研究)。
- (2) 新たに設計した高機能不斉有機分子触媒の機能発現メカニズムの多面的解析と、その結果を元にした、新発想型不斉有機触媒及び不斉金属配位子の開発 (田村研究室との共同研究)。
- (3) これら知見を、普遍元素 (Fe, Ca 等) を利用した不斉反応系の開発に適用し、新たな脱希少元素型不斉反応系の開拓についても鋭意検討する。

【主な研究テーマ/実績テーマと内容】

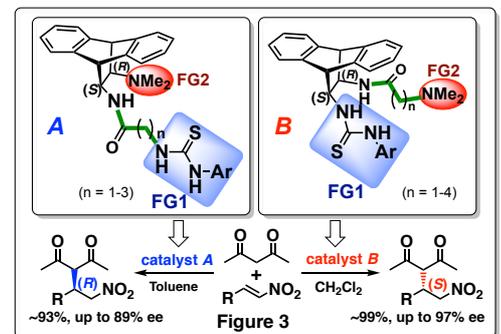
(1) 単純複素五員環を利用した生物活性物質類の汎用合成法の開発 (Figure 1, [A],[B]) : 単純複素五員環である 2-オキサゾロン、2-イミダゾロンなどの二重結合部位の付加反応活性を利用して、医農薬品を始めとする様々な生物活性物質の主要構造として注目されている様々なタイプの光学活性 2-アミノアルコールや 1,2-ジアミンなどの簡便キラル合成法の開発。



(2) 単純複素五員環を利用した高度不斉補助剤・触媒の開発 (Figure 1, [C]) : 2-オキサゾロン、2-イミダゾロン、2-チアゾロンと環状ジエン類との環化付加により容易に得られる三環性“屋根付き”人工不斉源を、
i) 不斉補助剤として利用した高度ジアステレオ選択的不斉反応系の開発、並びに、
ii) 開環して二座型不斉配位子または不斉有機触媒として利用したエナンチオ選択的不斉反応系への適用。



(3) “屋根付き” *cis*-1,2-ジアミン-Ru(II)錯体を用いたケトン・イミン類の高エナンチオ選択的不斉還元反応 (Figure 2) : 従来型 *trans*-1,2-ジアミン (DPEN)-Ru(II)錯体よりも強力な触媒活性。



(4) 配座固定「堅い」*cis*-1,2-ジアミン母核と「柔らかい」側鎖との組み合わせを利用した新規二官能性不斉有機触媒の開発 (Figure 3) : 「柔らかい」リンカー付き配座固定「堅い」屋根型二官能性有機触媒 **A, B** 2タイプを新規に合成、不斉 Michael 反応に適用した。双方とも高い化学収率とエナンチオ選択性を示したが、タイプ **A, B** では各々逆のエナンチオマー生成物を与え、タイプ **B** では極めて高い触媒活性 (0.05 mol%) と実用的な中規模スケールへの適用性を示した。

【企業との共同研究の実績】

現在のところ無し。過去サンプル供与歴有り。