

N 原子を足がかりとした近傍炭素上への官能基導入反応

シーズ技術名

技術分野分類 薬学 7806 創薬化学

技術キーワード 遷移金属触媒、C-H 活性化、Aza-Wacker 反応、アリルアミンユニット導入

産業分類 E 製造業 165 医薬品製造業

	概要	窒素原子を含む医薬品合成中間体や天然生理活性物質は、数多く知られている。それぞれの作用をより有効な物質にするために窒素原子を足がかりにより有効な化合物へ誘導するための反応の開発を行っている。
内容	従来技術・競合技術との比較(優位性)	足がかりとする窒素原子には、生体成分や天然有機化合物にもよく見られる単純な1級アミンから検討した。このアミノ基を足がかりにまずは窒素原子の導入を目指し、その窒素源となるアミノ基のユニットには、イソシアナートから容易に誘導可能であり、また塩基による活性化も可能であるウレアユニットを選択した。そのウレアユニットから窒素原子を母殻に導入する際には、いずれもPd触媒を利用する2種類の反応で導入に成功した。ひとつは、Pd触媒によるアリル位へのC-H活性化によるアリルアミンの合成、そして二重結合に対するウレアの付加反応、所謂 aza-Wacker 反応によるアリルアミンユニットへ誘導と、合成中間体として有用なアリルアミンを生成すると共に、窒素原子の導入にするものである。
	本技術の有用性	アリル位へのC-H活性化によるアリルアミンの合成では、鎖状化合物で有効であり、置換基が存在しても良好な収率でアリルアミンを持つジアミン体へと導くことに成功した。しかも、置換基が存在することで立体選択的に反応が進行することが明らかとなっている。ただ、環状化合物では、立体選択性、反応性が低いことから、aza-Wacker 反応の条件が有利となっている。
		以上のように窒素原子を起点にアリルアミンユニットへの導入が可能になったことから、生理活性化合物の合成にも適用可能である。
関連情報 (図・表・写真等)		<p>Allylic amination via C-H activation</p> <p>Aza-Wacker reaction</p>
技術シーズ保有者	氏名 所属・役職	原 梢 教授 名城大学 薬学部 薬学科
技術シーズ照会先	窓口 TEL/FAX e-mail	名城大学 学術研究支援センター Tel. 052 (838) 2036 Fax. 052 (833) 7200 sangaku@ccml.meijo-u.ac.jp

■知的財産

■試作品状況

無

提示可

提供可

作成日 2020年12月10日