

13 薬品合成を目指した高機能性活性化基と不斉触媒の開発

中村 修一

近年、光学活性な医薬品類の効率的かつ環境にやさしい合成技術の開発が強く求められている。そこで、本研究では、この社会的要請を解決する新しい不斉触媒の開発を行い、これまで達成が難しかった不斉合成反応を検討し、その困難の克服と共に、生物活性物質の部分骨格の構築を目指し研究を行った。

まず、新規の不斉触媒の創製を目指し、配位性置換基を導入した触媒分子を開発した。本触媒の機能性を確認するために、これまでに全く報告例のないアジリジンの酸化的不斉非対称化反応とマロノニトリルによる不斉開環反応を行ったところ、キナアルカロイド骨格にヘテロアレーンカルボニル基を導入した触媒が非常に高機能性を示すことが明らかとなった。特に、キナアルカロイド骨格にテトラゾール骨格を導入した触媒 **1** は、これまでに全く触媒デザインされた例はないものの、テトラゾール部位を有さない触媒と比べて、優位に高機能性を示すことが明らかとなった。また、ここで開発した触媒は、アジリジンの不斉開環反応を 1,000 倍以上活性化しながら、高立体選択的に反応が進行する。得られた生成物群は、光学活性な α -アミノカルボニル化合物、アミノ酸、トリアミン類へと変換が可能であり、合成的に有用であることも明らかにした。

開発した不斉触媒を用いた不斉合成反応

