

# 多環式有機化合物の合成法

豊橋技術科学大学

エレクトロニクス先端融合研究所

教授 柴富 一孝

# 新技術の概要

- ユニークな構造を持つ有機化合物の合成手法の開発
- スピロ構造を持つ種々の多環式有機化合物を合成
- 一部の化合物は高い光学純度で合成可能
- これまで合成されたことのない化合物を多数合成

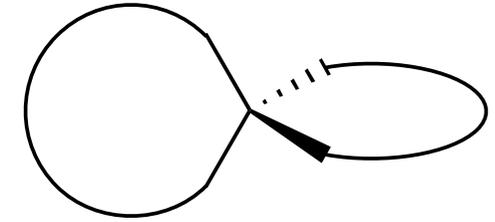
# 想定される用途

- 新規な**医薬品**、**農薬**のリード化合物探索への利用、もしくは**医薬品の合成中間体**としての利用
- 合成できる化合物群は、 $sp^3$ 混成軌道を多く含み**三次元的な構造の広がり**を持つこと、スピロ構造に起因する**剛直な分子構造**を持つこと、光学活性体としての合成も可能であること、などの特徴を持つことから上記目的への効果が期待できる

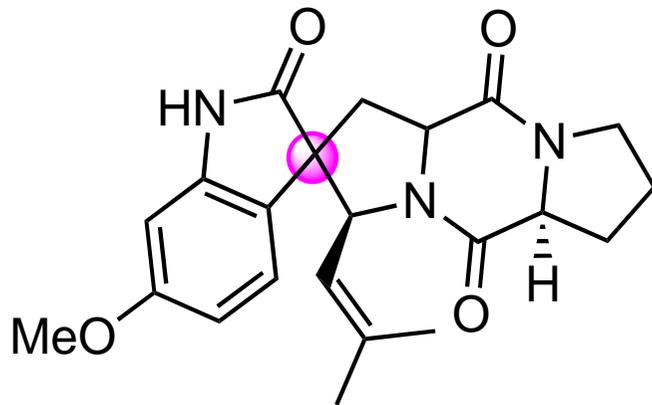
- 既存の手法では合成困難な化合物を合成できる
- 下記の構造的特徴を有している
  - ✓ スピロ構造に起因する剛直な分子構造
  - ✓  $sp^3$ 混成軌道を多く含み、三次元的な構造の広がりを持つ
  - ✓ 不斉炭素近くにカルボニル基を有しており、多様な類縁体調整が可能
- 同一の中間体から、比較的多様な分子骨格を構築できる

## 新規なスピロ化合物の合成法の開発

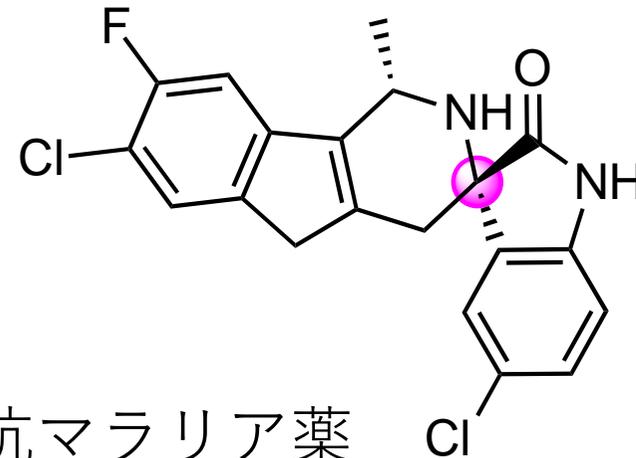
### ➤ スピロ構造



- ✓ 二つの環が一つの原子で結合した構造
- ✓ 構造にひずみが大きいため、一般的に化学合成が困難
- ✓ 医薬品にはスピロ構造を持つものが多い

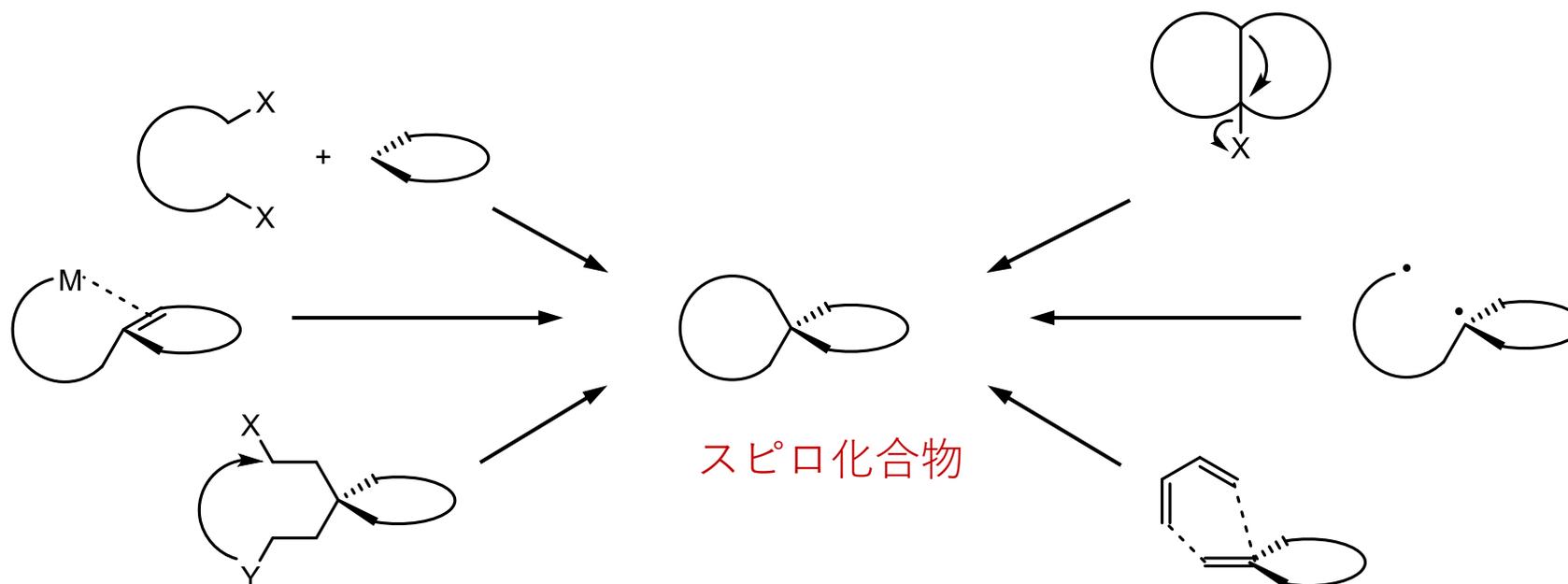


抗がん剤



抗マラリア薬

➤ 従来のスピロ化合物合成の例<sup>[1]</sup>

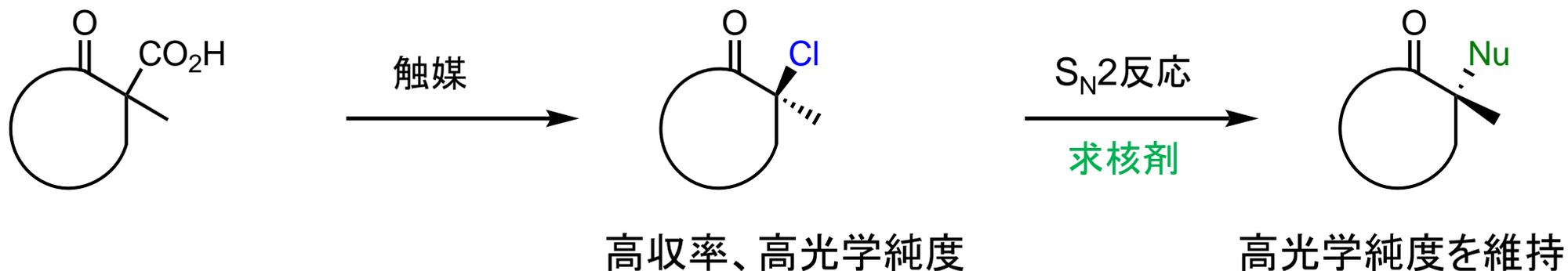


- ✓ 汎用性の高い手法が少ない
- ✓ 様々な環サイズのスピロ環を立体選択的に合成する手法が必要
- ✓ 高い光学純度での合成が困難

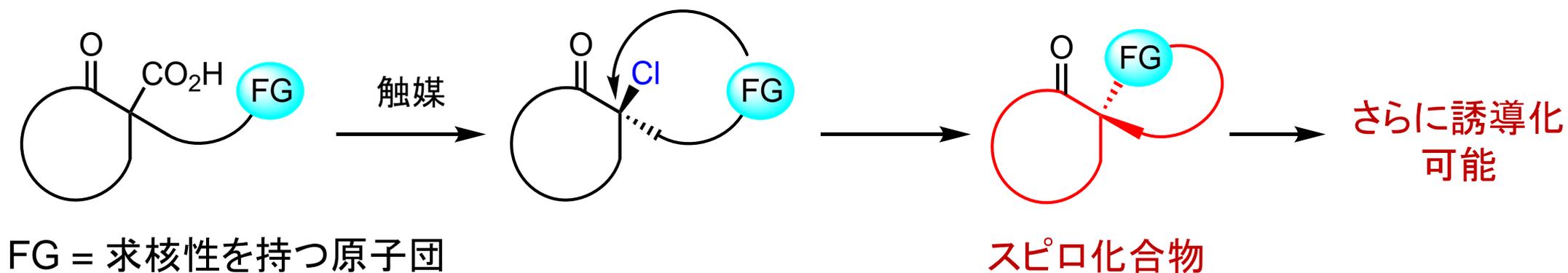
[1] R. Rios, *Chem. Soc. Rev.* **2012**, 41, 1060.

# 新技術の内容：今回の手法

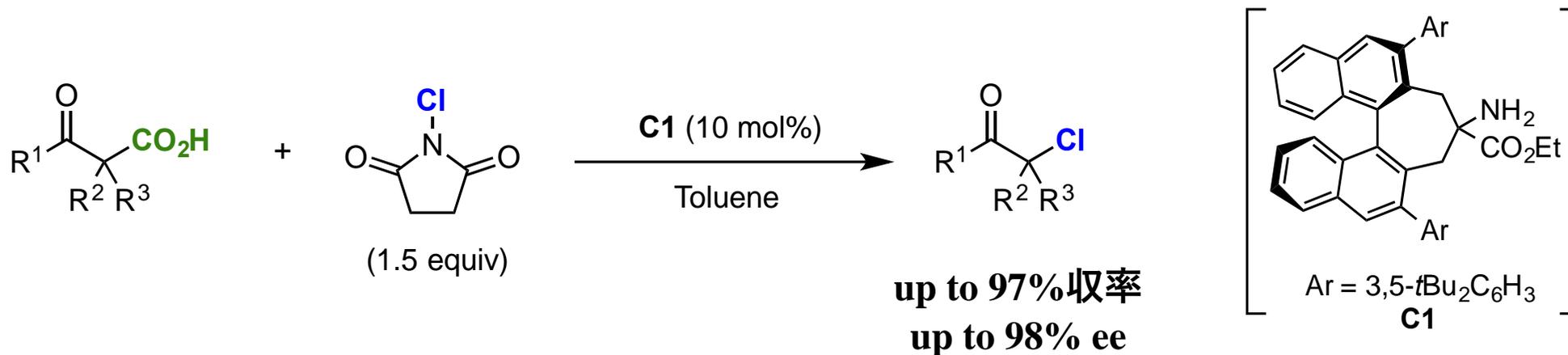
- 以前に我々が開発した反応：カルボン酸の脱炭酸的ハロゲン化



- 今回開発した合成手法

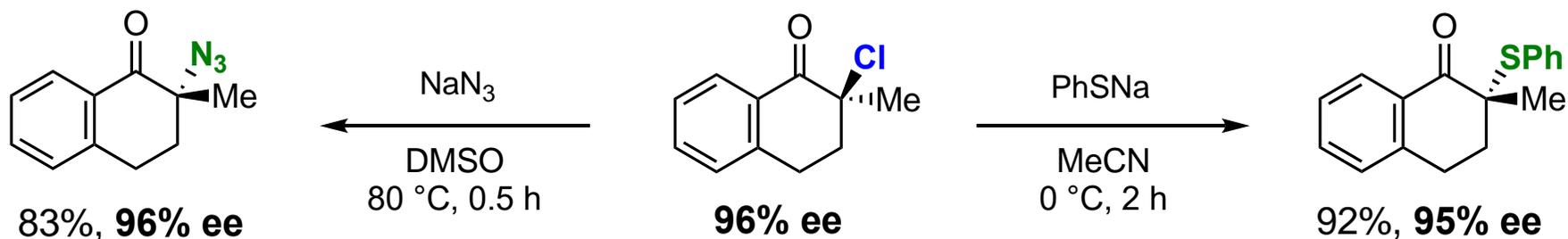


➤ カルボン酸の脱炭酸的ハロゲン化反応



*Nat. Commun.* **2017**, 8, 15600.

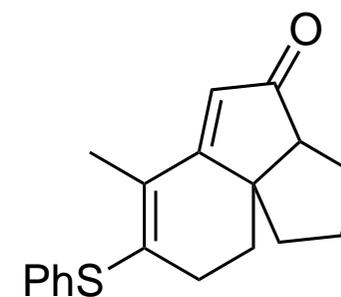
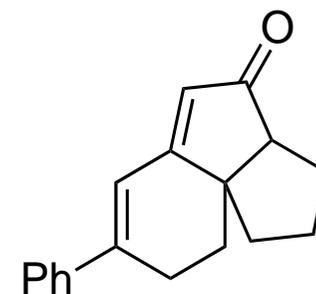
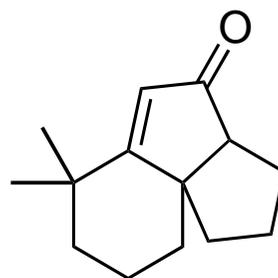
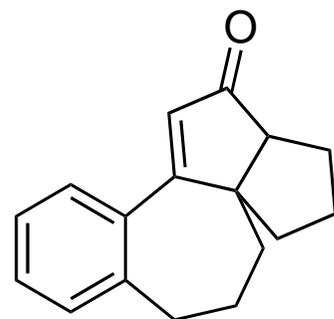
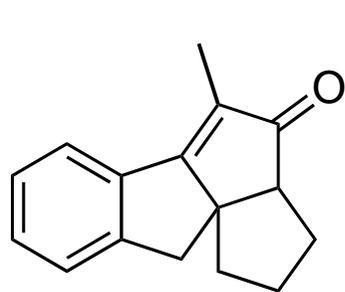
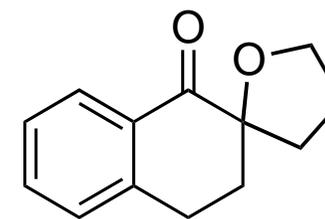
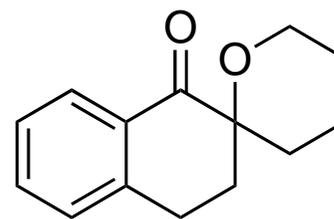
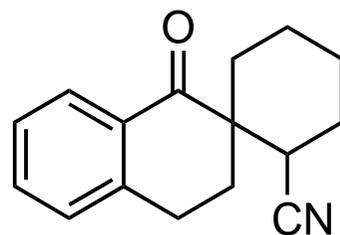
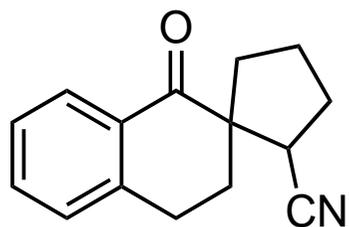
➤ 第三級炭素上でのSN2反応



*Nat. Commun.* **2017**, 8, 15600.

*Molecules* **2020**, 25, 3902.

➤ 合成したスピロ化合物、多環式化合物の例



- 課題：合成した化合物群の生物活性を調査して、医薬原料としての有用性を評価する必要がある
- 企業への期待：化合物の生物活性の調査、および医薬品合成中間体としての利用の可能性を提案していただきたい

- 発明の名称：スピロ骨格を内包する多環式化合物の製造方法および多環式化合物
- 出願番号：特願2021-207653
- 出願人：国立大学法人豊橋技術科学大学
- 発明者：柴富一孝、杉山瑛

# 本技術に関するお問合せ先

## 研究推進アドミニストレーションセンター

Phone: 0532 - 44 - 6975

FAX: 0532 - 44 - 6980

E-mail: [tut-sangaku@rac.tut.ac.jp](mailto:tut-sangaku@rac.tut.ac.jp) 担当: 白川正知