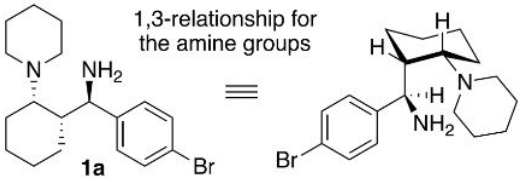
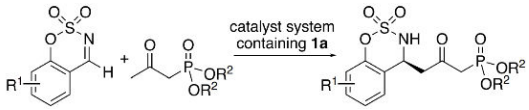
高選択的マンニッヒ反応のための新規1,3-ジアミン触媒

概要

第1級アミノ基と第3級アミノ基が同一原子上（または1,2-関係）にある化合物、例えば、キナ由来のアミン、シクロヘキサン-1,2-ジアミン、1,2-ジアリールエタン-1,2-ジアミンなどが、エノール化可能なケトンや求核性アルデヒドの結合形成反応を促進する触媒として使用されてきました。一方、1,3-ジアミン誘導体はあまり研究がなされていませんが、1,2-ジアミンよりもはるかに選択的な触媒として作用する可能性があります。
田中富士枝教授率いる研究チームは、酸と組み合わせるとγ位選択的不斉マンニッヒ反応の触媒として働く、エナンチオピュアな1,3-ジアミンの新規ファミリーを設計しました。特に、化合物1aは温和な条件下で高いエナンチオ純度と収率を示します。本研究は、安価な反応プロトコールで高エナンチオ純度を達成するためのスマート触媒の開発において、画期的意義を有します。



1,3-ジアミン触媒化合物1a



1aはβ-ケトホスホネートのマンニッヒ反応を触媒し、γ位選択的生成物を与えます

技術のポイント

化合物1aと酸を組み合わせた触媒系は、温和な条件下で様々なケトンの位置及びエナンチオ選択的マンニッヒ反応に非常に有効です。例えば、β-ケトホスホネートのγ位選択的、エナンチオ選択的マンニッヒ反応の触媒となりますが、その際α位の反応生成物は生成されません。同チームが行った研究によると、化合物1a中1,3-の関係にある第1級アミノ基と第3級アミノ基が、触媒作用の際に協同的に働きます。

応用

- 化学工業
- 創薬

利点

- γ位での選択的反応
- 温和な条件
- 高いエナンチオ選択性

カテゴリー：
化学 & 材料科学

主任研究員：
田中 富士枝 教授

知的財産：
特許出願中

問い合わせ先：
沖縄科学技術大学院大学　技術移転セクション
tls@oist.jp または 098-966-8937