

所属・職・氏名	岩手大学工学部 応用化学科 展開化学 助手・青柳 重信
シーズ名	硫黄とアセチレンを出発原料とする医薬品の合成
シーズの概要	アセチリドと硫黄から容易に調製されるインチオラート 1 はチオケテン 2 と同様の反応性を示しアミンとの反応によりチオアミド 3 を与える。様々な置換基を有するアセチレンおよびアミン類を用いることで炭素鎖の伸長とアミノ基導入が一度に行なえ医薬品の母体骨格の構築の合成経路短縮が可能となる。 $ \begin{array}{c} \text{R}^1-\text{C}\equiv\text{C}-\text{Li} \xrightarrow{\text{S}} \text{R}^1-\text{C}\equiv\text{C}-\text{SLi} \rightleftharpoons \begin{array}{c} \text{R}^1 \\ \diagup \\ \text{C}=\text{S} \\ \diagdown \\ \text{Li} \end{array} \\ \text{1} \qquad \qquad \qquad \text{2} \\ \downarrow \\ \begin{array}{c} \text{S} \\ \parallel \\ \text{R}^1-\text{CH}_2-\text{C}-\text{NR}^2\text{R}^3 \\ \text{3} \end{array} \end{array} $ さらにプロパルギルエーテル 4 を原料とするとアルコキシ基の脱離を伴い・・・不飽和チオアミド 5 を与える。5 は脱硫、触媒的不斉還元により立体選択的に 6 を与え近年需要が高まっているジアリールプロピルアミン類の新規合成法となりうる。 $ \begin{array}{c} \begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{R}^5-\text{C}\equiv\text{C}-\text{OMe} \\ \text{4} \end{array} \xrightarrow[\text{3) R}^2\text{R}^3\text{NH}]{\begin{array}{l} \text{1) n-BuLi} \\ \text{2) S} \end{array}} \begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{R}^5-\text{C}=\text{C}-\text{C}(=\text{S})-\text{NR}^2\text{R}^3 \\ \text{5} \end{array} \xrightarrow[\text{2) H}_2, \text{ catalyst}]{\text{1) Desulfurization}} \begin{array}{c} \text{R}^4 \\ \\ \text{R}^5-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NR}^2\text{R}^3 \\ \text{6} \end{array} \end{array} $
その他参考資料	
共同研究機関・企業	
特許(出願)番号	