

令和元年5月24日

報道機関 各位

創薬への新しい切り札：
温和な条件下での
高反応性化学種発生法を開発

富山大学大学院医学薬学研究部（薬学）薬品製造学研究室の高山助教と松谷教授らは、温和な室温条件下で、非常に高活性な化学種オルトキノジメタンを発生させる方法を開発しました。本方法は、加熱や強塩基性などの過酷な条件を用いずに四員環開裂させるという、世界で初めて見つけられたオルトキノジメタン発生法です。本成果は、生体分子の修飾や医薬品開発などの創薬研究に、役立つことが期待されます。

つきましては、取材・報道方よろしくお願いたします。

記

1. 公表論文

掲載誌名：Chemical Communications

論文題目：Facile o-quinodimethane formation from benzocyclobutenes triggered by the Staudinger reaction at ambient temperature

研究内容：別紙資料のとおり

2. Web 公表日（Web 上での先行公開であり、雑誌掲載日ではない）

論文：令和元年4月30日

3. 本件に関する問い合わせ先

富山大学大学院医学薬学研究部（薬学）

助教 高山亜紀, 教授 松谷裕二

tel：076-434-7530, 7531

e-mail：kohyama@pha.u-toyama.ac.jp, matsuya@pha.u-toyama.ac.jp

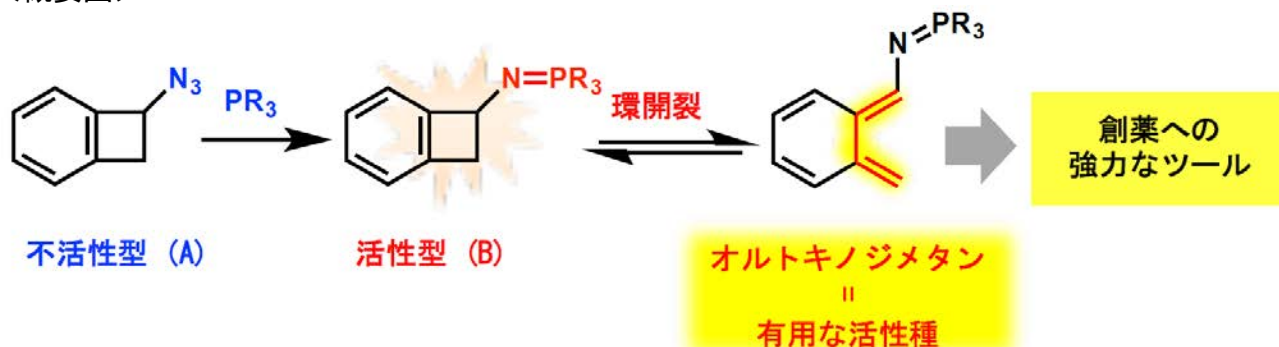
(別紙)

<研究の背景>

オルトキノジメタンは非常に反応性の高い中間体であり、医薬品の環構造の構築などに用いられてきた。したがって、オルトキノジメタンを簡便に発生させられれば、その高い反応性を生かして医薬品合成などの様々な反応に利用することができる。オルトキノジメタン自体は不安定かつ短寿命なので、前駆体から発生させる必要がある。一般的なオルトキノジメタン発生法として、四員環の開裂を利用した方法が知られているが、加熱や強塩基性といった激しい条件を必要とするため、温和な方法の開発が求められていた。

我々の研究室では、四員環上の置換基の電子的な性質を利用することで、環開裂の反応性を制御できると考え研究に着手した。

<概要図>



<研究の内容>

我々は、加熱や強塩基を必要としない温和なオルトキノジメタン発生法を開発した。この方法では、室温下での温和な分子変換反応を一度経由することで、室温で不活性な四員環 (A) を活性型 (B) に変換している。活性型の四員環 (B) は、室温下で直ちに開裂し、オルトキノジメタンを与えた。発生する活性種は室温下での分子連結方法に利用可能であったため、生体分子の修飾反応や、ステロイド等の医薬分子合成といった創薬分野への応用展開が今後期待される。

<論文情報>

著者：高山亜紀 (Aki Kohyama), 是澤恵莉 (Eri Koresawa),
 柘植清志 (Kiyoshi Tsuge), 松谷裕二 (Yuji Matsuya)

所属：富山大学大学院医学薬学研究部 (薬学)

題目：Facile o-quinodimethane formation from benzocyclobutenes triggered by the Staudinger reaction at ambient temperature

雑誌：Chemical Communications