

報道関係各位

2019年4月23日

国立大学法人東京医科歯科大学

「アルキニルスルフィド類の効率的な新規合成法を開発」 — 医薬品開発などに有用な複素環式化合物合成を可能にする新技術に期待 —

【ポイント】

- 末端アルキンから、効率よく多彩なアルキニルスルフィドを合成できる新たな技術開発に成功しました。
- 本手法を利用することで、幅広い複素環式化合物を簡便に合成できるようになりました。
- 本手法は、医薬品をはじめ、有機材料などの開発に広く役立つことが期待されます。

東京医科歯科大学 生体材料工学研究所 生命有機化学分野の細谷孝充教授、吉田優准教授、金本和也 特任助教（現・中央大学 理工学部 助教）は、アルキニルスルフィド類を合成する簡便な手法の開発に成功しました（図1）。この手法により、末端アルキンからアルキニルスルフィドを、悪臭を伴うことなく効率的に合成できます。同グループはさらに、合成した多彩なアルキニルスルフィド類を、引き続き反応によって様々な複素環式化合物に変換できることも明らかにしました。本手法を鍵とする合成化学が、ライフサイエンス・創薬や材料科学などのきわめて幅広い分野で役立つことが期待されます。この研究は、文部科学省科学研究費補助金ならびに国立研究開発法人日本医療研究開発機構（AMED）の創薬等ライフサイエンス研究支援基盤事業（BINDS）等の支援のもとでおこなわれたもので、その研究成果は、2019年4月19日に、アメリカ化学会の有機化学専門誌 *Organic Letters* のオンライン版で発表されました。

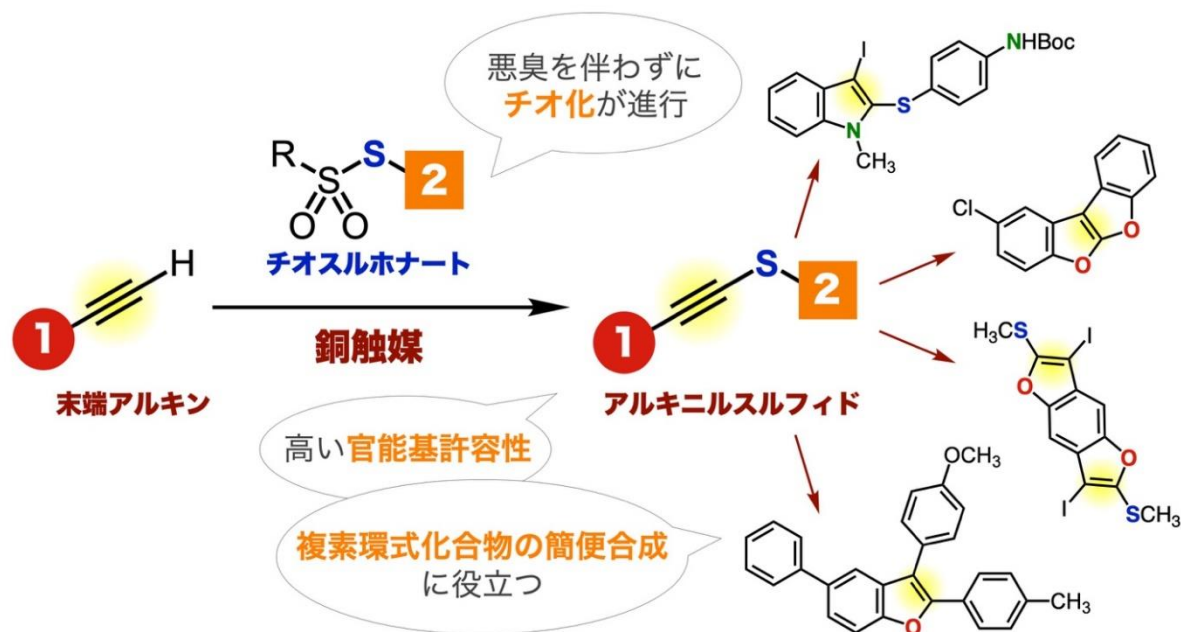
【研究の背景】

硫黄原子がアルキン（炭素-炭素三重結合を有する分子）の炭素に直接結合したアルキニルスルフィド類は、インドールをはじめとする広範な複素環式化合物の合成に役立つ重要な化合物群です。しかし、その合成法の開発は立ち後れており、穏和な条件でアルキニルスルフィド類を簡便に合成できる手法が求められています。

【研究成果の概要】

本研究グループは、銅触媒存在下、チオスルホナート^{*1}を硫黄源として用いて、末端アルキンからアルキニルスルフィドを効率的に合成できる新たな手法の開発に成功しました。本手法により、アミノ基、ヒドロキシ基、ブromo基、アセチル基といった官能基を有する多彩なアルキニルスルフィド類を簡便に合成できることが明らかになりました。さらに、従来法では合成の難しかった様々な複素環式化合物を、本手法を利用することで容易

に合成できることもわかりました。



【図1】アルキニルスルフィドの新規合成法と様々な複素環式化合物合成への応用

【研究成果の意義】

アルキニルスルフィド類から誘導される複素環式化合物は、医薬品や有機材料の候補化合物として有望な分子です。したがって、多彩なアルキニルスルフィド類の効率的な合成を可能にした本手法は、医薬品や有機材料の開発などに広く役立つと期待されます。

【用語説明】

*1 チオスルホナート

RSSO₂R'で表される化合物群。対応するチオール(RSH)やジスルフィド(RSSR')などから簡単に合成することができる。

【論文情報】

掲載誌: Organic Letters

論文タイトル: Synthesis of Alkynyl Sulfides by Copper-Catalyzed Thiolation of Terminal Alkynes Using Thiosulfonates

<http://dx.doi.org/10.1021/acs.orglett.9b00875>

【研究者プロフィール】

細谷 孝充(ホソヤ タカミツ) Hosoya Takamitsu

東京医科歯科大学 学生体材料工学研究所

生命有機化学分野 教授

・研究領域

有機合成化学、ケミカルバイオロジー



吉田 優(ヨシダ スグル) Yoshida Suguru

東京医科歯科大学 学生体材料工学研究所

生命有機化学分野 准教授

・研究領域

有機合成化学、ケミカルバイオロジー



【問い合わせ先】

＜研究に関すること＞

東京医科歯科大学 学生体材料工学研究所

生命有機化学分野 細谷 孝充(ホソヤ タカミツ)

吉田 優(ヨシダ スグル)

TEL:03-5280-8114 FAX:03-5280-8114

E-mail: thosoya.cb@tmd.ac.jp(細谷)、s-yoshida.cb@tmd.ac.jp(吉田)

＜報道に関すること＞

東京医科歯科大学 広報部広報課

〒113-8510 東京都文京区湯島 1-5-45

TEL:03-5803-5833 FAX:03-5803-0272

E-mail:kouhou.adm@tmd.ac.jp