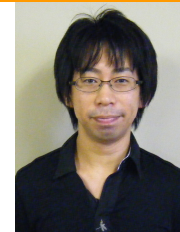


## シーズのテーマ: 生理活性物質の合成を指向した含フッ素化合物の合成法の開発

## 【研究者】

氏名: 樽井 敦 (たるい あつし)  
学部: 薬学部  
学科: 薬学科  
職階: 講師  
連絡先: ※下段、お問い合わせ先をご参照ください。



## 【研究の概要】

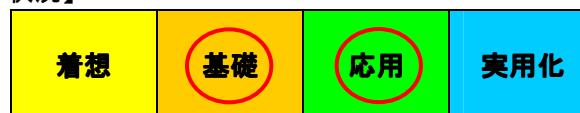
含フッ素ハロエステルを利用した含フッ素 β-ラクタムの合成および含フッ素 β-ラクタムを出発原料とした置換基導入反応の開発を行っています。加えて含フッ素ハロエステルを利用した反応はβ-ラクタムだけに限らず、アセタール類との反応に展開中で、統合失調症治療薬のフッ素類縁体の合成を計画しています。

含フッ素 β-ラクタムを出発原料とした反応からはコレステロール吸収阻害剤のフッ素類縁体や抗菌剤のフッ素類縁体が合成可能であると考えられます。これら生理活性物質のフッ素類縁体を合成し、フッ素が入ることによってどのように活性に変化を与えるのかを明らかにすることを長期目標として研究を展開しています。

## 【研究の特長・従来技術との比較】

有機亜鉛試薬を利用した反応ですが、特別な下処理を必要とする金属亜鉛を用いない反応を開発しています。比較的やりやすい方法での反応と言えます。

## 【研究の状況】



## 【課題、今後の方向性】

立体中心を有する化合物が合成ターゲットとなりますので、不斉合成の達成が必要となります。今後の標的分子の中心は統合失調症に効果が期待される化合物で、ドパミン受容体の選択的阻害作用の発現および選択性のコントロールを目標とします。

## 【用途・効果】

フッ素原子は分子中に導入されることで物理学的・化学的変化を有機分子に与えることができることが知られています。本特性を生かし、抗菌剤やコレステロール吸収阻害剤に利用されるβ-ラクタム骨格や統合失調症の治療薬にフッ素原子を導入することで、その活性の向上や作用の選択性を高めることが期待されます。

## 【関連資料・特許・文献・参考事項】

1. Tarui, A.; Kawashima, N.; Sato, K.; Omote, M.; Miwa, Y.; Minami, H.; Ando, A. *Tetrahedron Lett.* **2010**, *51*, 2000–2003.
2. Tarui, A.; Kondo, S.; Sato, K.; Omote, M.; Minami, H.; Miwa, Y.; Ando, A. *Tetrahedron* **2013**, *69*, 1559–1565.
3. Tarui, A.; Kawashima, N.; Kawakita, T.; Sato, K.; Omote, M.; Ando, A. *J. Org. Chem.* **2013**, *78*, 7903–7911.