

財団使用欄

令和3年4月28日 受理
No. 2

完了報告書

(兼 会計報告書)

2021年 4月26日

公益財団法人 シオノ健康財団
理事長 塩野谷 貫一 殿

個人の方

氏名 金田 京介



団体の方

団体名

代表者



貴財団より助成いただいた活動が完了いたしましたので、下記のとおり報告します。

活動内容	生命科学現象の可視化を志向したスルホンアミドを含む中員環アルキンの創出
------	-------------------------------------

※今後の連絡に必要となりますので、全ての項目にご記入ください。

提出者に関する事項	(フリガナ) 氏名又は団体名	カネダ 京介	生年月日	
		金田 京介	又は設立年月日	
	(フリガナ) 提出担当者	カネダ 京介		
		金田 京介		
	住所	〒006-0011 北海道札幌市手稲区前田7条15-4-1 (TEL) 011-676-8626 (FAX) 011-676-8666 (E-mail) kaneda@hus.ac.jp		
	連絡先 郵送先	〒006-0011 北海道札幌市手稲区前田7条15-4-1 (TEL) 011-676-8626 (FAX) 011-676-8666 (E-mail) kaneda@hus.ac.jp		

※提出後の住所・連絡先変更の際は、速やかに事務局までご連絡ください。

I. 活動成果及び今後の課題

(注) 各項目の記述には必要な分量のスペースを使ってください。

(1) 活動成果

生体内に適用可能な化学連結反応による生命科学現象の可視化を志向し、設計したスルホンアミド含有の中員環アルキンの有機合成、構造解析及びそれらの成果発表を行った。

- ① 有機合成：薬学部卒業研究生2名とともに有機合成化学の実験を行ない、設計した2つのスルホンアミド含有11員環アルキンを中程度の収率にて得た。その際、触媒的光延反応の反応条件の検討を行ったが、予想に反して生成が困難であることが判明した。また、スルホンアミドに部位に付加しているカルバメート基を除去する目的で酸性条件に晒し、その結果を確認した。さらに環状アルキンの接触水素還元などを行い、環状アルキン部位の反応性を確認し、中員環スルホンアミド誘導体化反応をいくつか試みた。これらの結果は、本年5月に学内で実施予定の卒業研究発表会や卒業研究論文集として公表予定である。
- ② 構造解析：有機合成より創出した化合物類は、北海道大学グローバルファシリティセンターの協力の下、精密質量分析を行ない構成元素の解析および確認を行った。また、東京薬科大学中央分析センターの協力の下、環状アルキンとアルケン誘導体を検体とした単結晶 X 線構造解析を行ない、スルホンアミド結合の長さやアルキン部位の角度、化合物全体の3次元立体配座を解析した。これらの結果は、構造有機化学系の学術論文にて報告予定である。
- ③ 成果発表：2020 バイोजパン（パシフィコ横浜開催の産学官技術イベント）にて本研究の概要や目的・意義などを「生命科学に有益な機能性分子の設計と創製」として報告・発表している。詳細な活動の内容は本学ホームページ (https://www.hus.ac.jp/hit_topics/2020/10/202010214237.html) や4ページ目にある記録写真を参照いただきたい。

(2) 今後の課題

現状、創出したスルホンアミド含有11員環アルキンは、生命科学現象の可視化に適用できるほどの実用レベルには達していないと考えられる。到達するためには、いくつかの解決すべき今後の課題がある。

- ① 歪みエネルギーの課題：創出したアルキンとアジドとの環化付加反応（いわゆるクリック反応）を行い、その反応性を検証する必要がある。先の構造解析より、アルキン部位に係る歪み（エネルギー）は予想よりも小さく、環化反応を室温（体温）にて促進させるだけの十分な駆動力にはならないと考えられる。例えば9員環にみられたエネルギーに関わる“分子内の渡環型水素結合”の形成のための新たな分子設計の工夫を検討する。
- ② 合成法の簡便化の課題：合成法の鍵となる反応に触媒的光延環化反応があるが、現在のところ試薬が量論量必要で触媒化には成功していない。この原因は、触媒サイクルに高温が必要で反応物が耐えられないことが挙げられる。したがって触媒を改良し低温化でのサイクル化を可能にするか、反応物を高温に耐えうるように設計し直す必要がある。
- ③ 成果公表に向けての課題：ひとまずスルホンアミド含有11員環アルキンの創出にて構造有機化学系の学術誌に論文投稿を試みるが、データの整理と既報の関連論文が過不足なく網羅されているかを確認する必要がある。

記録写真等貼付欄（画像印刷可）

活動の様子を記録した画像・写真等がある場合は、このスペースに貼付してください。

※スペースが足りない場合は、別途添付してください。

お送りいただいた写真等は原則として返却いたしませんのでご注意ください。

バイオジャパンにて展示したポスターと発表の様子

分子創製化学ユニット
生命科学に有益な機能性分子の
設計と創製

2023年度バイオジャパン
国際会議「2023
バイオ・山形・東京
国際会議」
2023年度バイオジャパン
国際会議「2023
バイオ・山形・東京
国際会議」

①リン原子の特性を利用したホスフィン配位導体の創製

ホスフィン配位導体はリン原子を軸として、ホスフィン配位導体の構造、配位能力、安定性、反応性、触媒活性などを調節可能な構造を持つ。また、ホスフィン配位導体は、ホスフィン配位導体の構造、配位能力、安定性、反応性、触媒活性などを調節可能な構造を持つ。

②アミノベンゼンホルムアミドを含有した環状化合物の創製

アミノベンゼンホルムアミド構造は、
・優れた安定性を示す（ホスフィン配位導体の安定性向上）
・配位能力、反応性の向上や配位能力の向上に導く。
・高純度での合成が可能で、高純度の化合物が得られる。

アミノベンゼンホルムアミドを含有した環状化合物は、
・アミノベンゼンホルムアミド構造を含有する環状化合物の創製
・アミノベンゼンホルムアミド構造を含有する環状化合物の創製
（お問い合わせ：YAMAGUCHI UNIVERSITY 1003-1004 42000）



創出した化合物の構造解析図（結晶解析および計算化学での処理）

