

# 超原子価ヨウ素を活用する遷移金属を用いない芳香族アミン合成

工学研究科 応用化学専攻

助教 清川 謙介

Researchmap <https://researchmap.jp/kensukekiyokawa>



## 研究の概要

芳香族アミンは、医薬品、農薬、有機材料などに広く利用される重要な化合物群であり、その効率的な合成法の開発は有機化学における重要な課題である。本研究では、ヨウ素原子上に多様なアミノ基を導入した新規な超原子価ヨウ素反応剤（アミノヨードン）の合成に成功し、これらを用いることで芳香族ボロン酸の求電子的アミノ化反応が進行することを見出した。本手法により、遷移金属を用いることなく多様な芳香族アミンを合成することが可能となり、従来法では困難であった化合物の合成にも応用できることを示した。

コストを要する点が大きな問題となっている。したがって、遷移金属を用いない効率的な合成法の開発が強く求められている。

本研究では、ヨウ素原子上に多様なアミノ基を導入した新規な超原子価ヨウ素反応剤（アミノヨードン）の合成に成功し、これらを用いることで芳香族ボロン酸の求電子的アミノ化反応が進行することを見出した。本手法により、遷移金属を用いることなく多様な芳香族アミンを効率的に合成でき、従来法では合成が困難であった化合物の構築も可能となった。

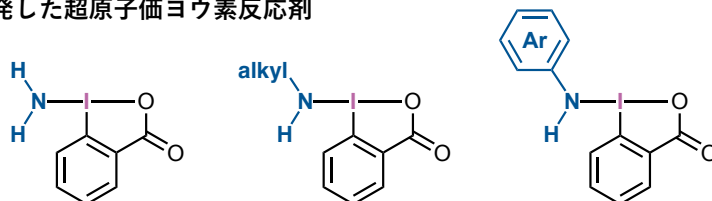
## 研究の意義と将来展望

本研究で開発した手法は、遷移金属反応剤を用いることなく多様な芳香族アミンを合成できる点で、医薬品や有機材料分子の合成法の発展に大きく貢献する可能性を有する。これは、極微量の金属が残存するだけでも、医薬品における毒性や有機材料の物性に深刻な影響を及ぼすためである。さらに、本手法は反応工程の簡略化によるエネルギー消費の低減にもつながり、環境負荷の軽減や資源の有効利用を通じて、持続可能な社会の実現にも寄与することが期待される。

## 研究の背景と結果

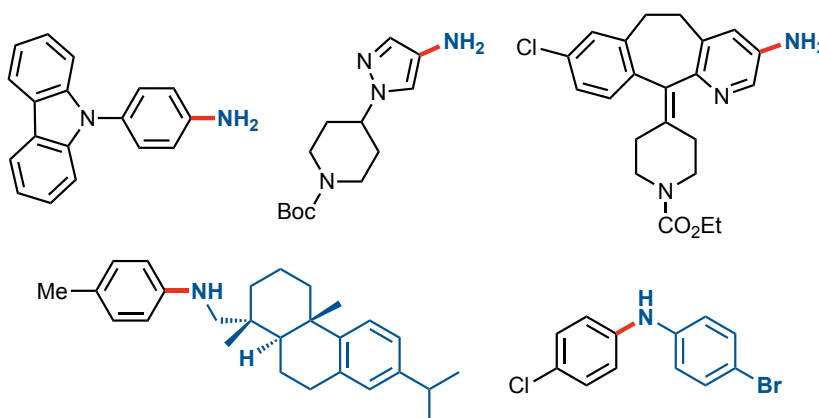
芳香族アミンは、医薬品、農薬、有機材料などに広く利用される重要な化合物群であり、その効率的な合成法の開発は有機化学における重要な課題である。芳香族アミンの合成には、炭素-窒素結合形成反応が最も一般的に用いられ、特に遷移金属触媒を利用する手法が広く発展してきた。しかし、ファインケミカルの合成においては、生成物中の金属残渣を完全に除去する必要があり、そのために多大な労力と

### ・開発した超原子価ヨウ素反応剤



様々なアミノ基を導入可能な超原子価ヨウ素反応剤を開発！

### ・開発した超原子価ヨウ素反応剤を用いて合成可能な芳香族アミンの例



医薬品や有機材料分子の候補となりうる様々な芳香族アミンを迅速に合成可能！

特許

論文

Kiyokawa, Kensuke; Kawanaka, Kazuki; Minakata, Satoshi. Amino- $\lambda^3$ -iodane-enabled electrophilic amination of arylboronic acid derivatives. *Angew. Chem. Int. Ed.* 2024, 63(12), e202319048. doi: 10.1002/anie.202319048

Kawanaka, Kazuki; Kiyokawa, Kensuke; Minakata, Satoshi et al. Versatile method for the synthesis of aminobenziodoxolones and its application to one-pot coupling of arylboronic acids with simple amines. *Chem. Sci.* 2025, 16(41), 19389-19396. doi: 10.1039/D5SC06301A

参考URL

<http://www.chem.eng.osaka-u.ac.jp/~minakata-lab/>

キーワード

有機合成、芳香族アミン、ヨウ素、創薬、有機材料