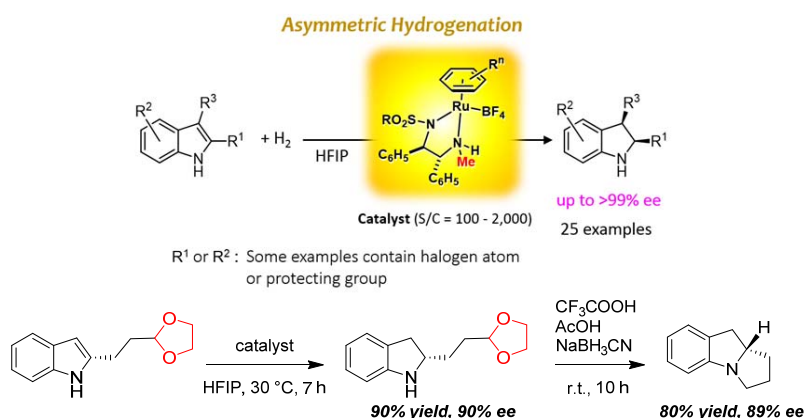


平成28年 8月17日  
千葉大学 大学院理学研究科

### 医薬に重要なインドリン化合物の実用的な触媒的不斉合成に成功

本研究は、千葉大学(学長：徳久剛史)大学院理学研究科基盤理学専攻 荒井孝義教授(分子キラリティー研究センター兼任)と高砂香料工業(株) 峠太一郎氏(現、千葉大学大学院理学研究科博士後期課程)の産学連携により実行された。本研究では、「光学活性インドリン化合物の触媒的不斉合成」に成功した。多彩な光学活性インドリン化合物の実用的な触媒的不斉合成が達成され、新規医薬品等の開発に繋がる可能性がある。

インドリンは、種々の天然物や生物活性物質に見いだされる重要な分子骨格である。この魅力あるインドリンを光学活性体として合成する直截的方法は、置換インドールの触媒的不斉還元であるが、従来の手法では保護基の利用や強い酸性条件が必要であった。今回、カチオン性のスルフォニルジアミン-ルテニウム触媒(下図)を用いる事でこの問題を解決した。反応は1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロイソプロパノール(HFIP)溶媒中、ルテニウム金属と配位窒素上のプロトンによる水素結合の協調作用によって速やかに進行し、幅広い基質一般性をもって2位および3位が置換された光学活性インドリンを非常に高い光学純度で得る事ができる。特に、これまで酸性条件下に用いる事ができなかった置換基や官能基を有する基質にも用いる事ができる。例えば、本還元反応を用いる事で、ピロロインドリンの超短工程触媒的不斉合成も可能になった。



Touge, T.; Arai, T. *J. Am. Chem. Soc.* **2016**, *138*, [DOI: 10.1021/jacs.6b06295]

本件に関するお問い合わせ先  
千葉大学大学院理学研究科 (教授 荒井孝義)  
Tel : 043-290-2889 Fax : 043-290-2889  
E-mail : tarai@faculty.chiba-u.jp