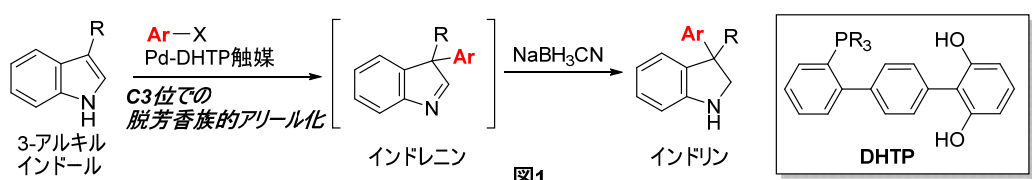
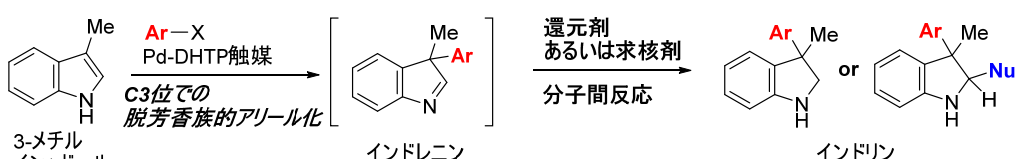


研究区分	教員特別研究推進 地域振興
------	---------------

研究テーマ	Pd-DHTP 触媒を用いる 3-置換インドールの C3 位選択的な脱芳香族的アリール化によるインドレニン合成と多様なインドリン類への変換				
研究組織	代 表 者	所属・職名	薬学部・助教	氏名	山口 深雪
	研究分担者	所属・職名		氏名	
		所属・職名		氏名	
		所属・職名		氏名	
	発 表 者	所属・職名	薬学部・助教	氏名	山口 深雪

講演題目	
Pd-DHTP 触媒を用いる 3-置換インドールの C3 位選択的な脱芳香族的アリール化によるインドレニン合成と多様なインドリン類への変換	
研究の目的、成果及び今後の展望	
静岡県の主要産業のひとつに医薬品産業がある。医薬品産業や化学産業において、有機化合物の合成に様々な化学反応が活用されている。そのため、有用な化学反応の開発研究は、有機化学の学問的発展のためだけでなく、産業の発展にも重要な寄与をもたらす。申請者はこれまで、遷移金属触媒を用いる効率的化学反応の開発研究に取り組んできた。中でも、申請者らが開発したインドール類の C3 位選択的脱芳香族的アリール化は、入手容易なハロアレーンをアリール化剤として用いることができ、画期的なものである（図 1）。成功の鍵は、当研究室で開発された基質捕捉型配位子 DHTP の使用である。 そこで今回、この反応で合成できるインドレニン体に対し、NaBH₃CN 以外、NaBH₃CN 以外の種々の求核剤を反応させ、置換インドリン類の効率的合成法の確立を目的として研究を行った（図 2）。アリール化の最適反応条件を用いて、3-メチルインドールから C3 二置換インドレニンを合成した。その後、精製せずに NaBH₄ を還元剤として用いる還元反応について検討したところ、NaBH₄ を用いても反応が良好に進行することを見出した。続いて炭素求核剤として Grignard 試薬を用いる反応を検討した。その結果、MeMgBr のインドレニン C2 位への付加がジアステレオ選択的に進行した。続いて基質一般性の検討を行い、様々な置換インドリン類を得た。 この手法により、従来よりも簡便に多置換インドリン類が合成できるようになると期待できる。また、インドレニンと炭素求核剤との反応は研究例が少ないことから、本研究の活用により新たな研究領域の開拓につながると考えている。	
 図1	
 図2	