

研究区分	教員特別研究推進 独創・先進的研究
------	-------------------

研究テーマ	位置選択的触媒反応を実現する基質捕捉型配位子 DHTP の研究				
研究組織	代表者	所属・職名	薬学部・教授	氏名	眞鍋 敬
	研究分担者	所属・職名	薬学部・准教授	氏名	小西 英之
		所属・職名	薬学部・講師	氏名	岩本 憲人
		所属・職名	薬学部・助教	氏名	山口 深雪
	発表者	所属・職名	薬学部・教授	氏名	眞鍋 敬

**講演題目**

位置選択的触媒反応を実現する基質捕捉型配位子 DHTP の研究

**研究の目的、成果及び今後の展望**

医薬品候補化合物等の精密有機合成において、位置選択的な触媒反応は、合成の効率・簡便性を大きく向上させる可能性をもつ有用な戦略の一つである。しかし多くの例では、出発物質自体の最も反応性の高い位置で反応するのみであり、出発物質自体がもともと示す位置選択性に反して合成者の思い通りの位置選択性を実現するのは依然として困難である。そのような中、研究代表者らは、これまでにない位置選択性を実現する触媒の開発に取り組んできた。その過程で、パラジウム触媒の配位子である DHTP (dihydroxyterphenylphosphine) を開発し、様々な位置選択的反応に応用してきた。しかし現在までのところ、その位置選択性の発現機構は完全には明らかになっておらず、また選択的触媒反応への適用範囲も狭い。そこで本研究では、DHTP による位置選択性発現を活用した触媒反応の適用範囲を広げる目的で、位置選択的脱芳香族的アリール化を活用した多置換ピロロインドリンの合成反応の開発検討を行った。

種々検討の結果、側鎖にメチル基を有するトリプタミン誘導体の脱芳香族的アリール化を、パラジウムと Cy-DHTP とを組み合わせた触媒を用いることで、位置選択的かつジアステレオ選択的に行うことができるようになった。また、側鎖にフェニル基を有するトリプタミン誘導体を用いると、ほぼ完璧なジアステレオ選択性を示すことが明らかとなった。このジアステレオ選択性は、第一段階の脱芳香族的アリール化の段階で発現していることも明らかとなった。今後は、DHTP が位置選択性およびジアステレオ選択性の発現にどのように関与しているのかを引き続き研究する予定である。

