

【成果報告】

炭素原子の4つの結合がすべて異なる場合、その分子と鏡に映ったその分子は重ね合わせることができない。実像と鏡像が重ね合わせることができない右手と左手の関係になる。これらを鏡像異性体という。鏡像異性体を光学活性分子という。医薬品や農薬などは、鏡像異性体で薬理作用が異なることが多く、医薬品では鏡像異性体の片方だけが必要となる。

炭素以外の原子を環の構成元素に持つ有機化合物を複素環化合物という。複素環化合物は医薬品の基本構造として極めて重要である。光学活性アセチレンアルコールや光学活性複素環化合物の需要は高いにも関わらず、必要とされる構造を効率的に提供する有効な方法が限られている。本研究では、独自に発展させてきた触媒を用いて光学活性アセチレンアルコールと光学活性複素環化合物の両方を同時に効率的に合成することを目的とした。

本研究では、速度論的光学分割という手法を用いた。インドールは、多くの生物活性物質中に存在する骨格である。それらの中でアルキンが置換した光学活性体のインドールは申請者が知る限り得られていない。申請者が開発した触媒を用いてインドールとアセチレンアルコールから光学活性体のアルキン置換インドールを高収率かつ高エナンチオ選択的に得ることに成功した。副生成物は水だけである環境調和合成を達成できた。これはラセミ体のアルコールの片方だけが立体特異的に置換されることを示している。そのため反応しないアルコールも光学活性体で得られる。本反応では、インドール、アセチレンアルコール共に高い鏡像体過剰率で得られた。ここで得られる光学活性アセチレンアルコールは、falcarinol, falcarindiol, panaxytriol, panaxydolなどの天然物に見られる骨格で、有用な光学活性ビルディングブロックである。二つの有用な光学活性体が同時に得られる有用な合成法を確立できた。

