

創薬を指向した環境調和型有機金属触媒の開発とその応用

Development of Environmentally Benign Organometallic Catalysis for Drug Discovery and its Application

有澤 光弘

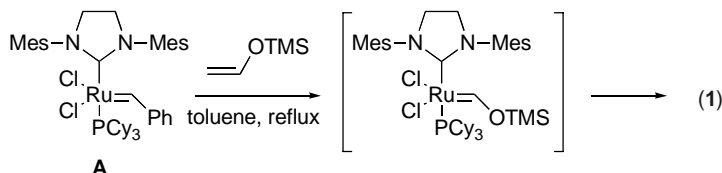
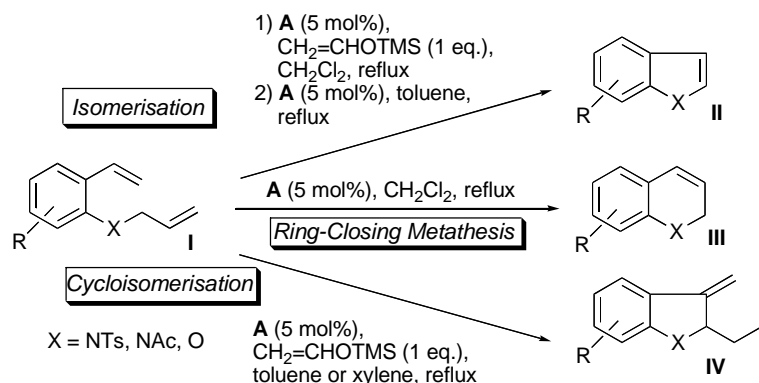
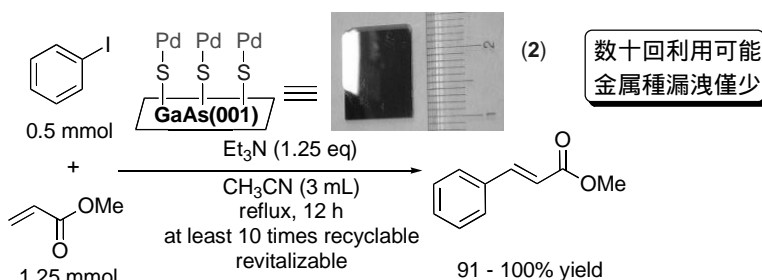
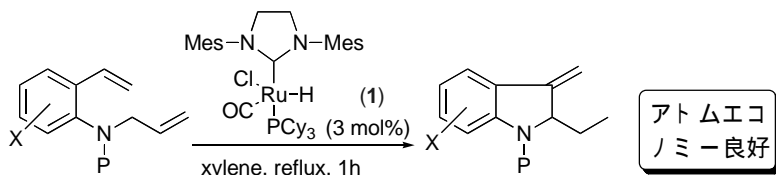
北海道大学大学院薬学研究院

Mitsuhiro ARISAWA, Graduate School of Pharmaceutical Sciences, Hokkaido University

有機金属触媒を用いる炭素-炭素結合形成反応は現在の有機合成化学に不可欠であり、基礎研究に留まらず、創薬を始めとする応用研究、更に工業的にも広く用いられている。筆者らは創薬化学上有用な新しい有機金属触媒や新しい反応の開発について研究を行い、2つの新しい触媒の開発に成功した。含窒素複素環リガンドを有するルテニウムヒドリド（触媒 1）は「良好なアトムエコノミーでインドール誘導体を合成できる」点、半導体担持型有機パラジウム触媒（触媒 2）は溝路木—Heck 反応において「数十回利用が可能であり且つ反応溶液中への金属種漏洩量が僅かである」点でどれも環境調和型触媒である。本講演では、これら新触媒開発の経緯と生物活性天然物合成への応用について述べる。

触媒 1 本触媒は従来のルテニウムヒドリドが有していたオレフィンの異性化に加え、環化異性化反応を経てインドール骨格を構築できる点で特長があり、第 2 世代 Grubbs 触媒 (A) と組み合わせることにより、*N*-アリル-*o*-ビニルアニリン (I) から創薬上重要な含窒素複素環インドール(II)、キノリン(III)、インドリン(IV)を作り分ける事が可能である。

触媒 2 本触媒の最大の特徴はピンセットでつまめる取扱容易性である。X 線光電子分光実験 (XPS) から硫黄終端 GaAs(001) に担持されている Pd が溝路木—Heck 反応の前後で 0 価を維持していることが明らかになった。



【謝辞】本研究の多くは千葉大学大学院薬学研究院で行ったものであり、終始ご指導頂いた中川 昌子先生、西田 篤司先生、共同研究者の皆様、絶えず温かく見守り励まして下さった大阪大学大学院薬学研究科 北 泰行先生、更に北海道大学大学院薬学研究院 周東 智先生に感謝致します。