

30F-am07

ラジカル環化反応を用いるオキシンドールの新規不斉構築法

○小野 裕之¹, 下川 淳¹, 福山 透¹ (¹東大院薬)

【目的】 3位に4級炭素を有するオキシンドール類には高い生理活性を有するものが多いことが知られているものの、現在まで効率的な不斉合成法は確立されていない。そこで我々は、当研究室で開発されたラジカル環化型のインドール合成法を応用することにより、オキシンドールの新規不斉合成法を実現できると期待し、研究に着手した。

【方法・結果】 アミノ酸を不斉補助基としたチオヒダントインユニットを有する α 、 β -不飽和オキシムを4-メチルキノリンから合成した。これをラジカル開始剤としてトリエチルボランを用いるラジカル反応条件に付したところ、環化反応が進行し、4級炭素を構築できることを見出した。さらに、オキシムの脱水反応によるニトリルの形成およびアミジン部位の加水分解を経てオキシンドールの合成に成功した。この時、不斉補助基をフェニルアラニンとした場合に中程度の光学純度ではあるが、オキシンドールを光学活性体として合成することに成功した。

