

## キラルルイス酸触媒活性化法に基づく不斉合成反応 の新展開：触媒的不斉共役付加反応を基盤とする機 能物質の合成研究(平成13年度 機能研所長リーダ シップ経費(若手奨励研究)による研究の紹介)

和田, 英治  
九州大学機能物質科学研究所

<https://doi.org/10.15017/7955>

---

出版情報：九州大学機能物質科学研究所報告. 16, pp.21-21, 2002. 九州大学機能物質科学研究所  
バージョン：  
権利関係：

# キラルルイス酸触媒活性化法に基づく不斉合成反応の新展開： 触媒的不斉共役付加反応を基盤とする機能物質の合成研究

和田 英 治

## New Development of Asymmetric Synthesis on the Basis of Activation Method with Chiral Lewis Acid Catalyst: Synthetic Study of Functional Materials Based on Catalytic Asymmetric Conjugate Addition

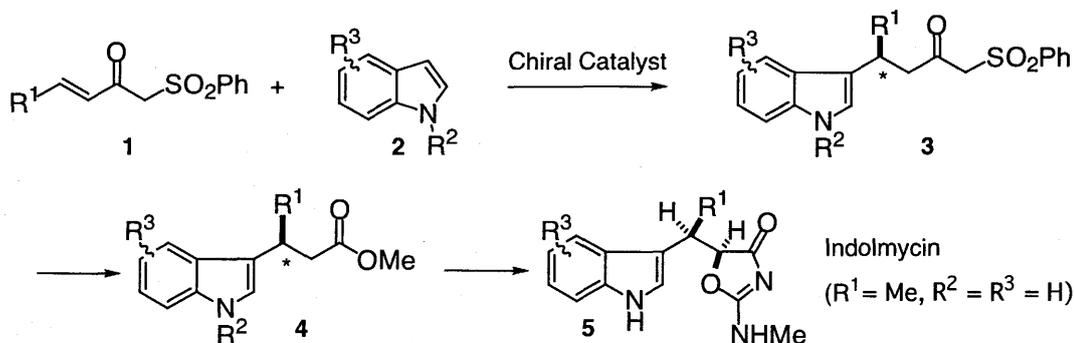
Eiji WADA

This research project aims to develop a new and effective catalytic asymmetric synthesis on the basis of an activation method using a chiral Lewis acid catalyst. From this viewpoint, an effective asymmetric conjugate addition reaction of electron-rich aromatic compounds to sulfonyl-functionalized enones is examined in the presence of chiral Lewis acids. Furthermore, the synthesis of a variety of optically active derivatives is also performed by the transformation of the  $\beta$ -keto sulfone moiety of conjugated adducts.

### 研究概要

本研究は、触媒的不斉合成反応に供するシンプル  $\alpha,\beta$ -不飽和ケトン等価体の活性反応基質として設計・合成した二座配位型官能基修飾  $\alpha,\beta$ -不飽和ケトンを用い、キラルルイス酸触媒活性化法による一般性・汎用性のある新規触媒的不斉反応プロセスの開拓を基盤とする不斉合成反応の開発を目的とする。すなわち、スルホニル官能化  $\alpha,\beta$ -不飽和ケトン **1** を共役付加反応の受容体基質として用い、触媒的不斉反応における未開拓領域である

種々の電子過剰芳香族化合物との共役付加型 Friedel-Crafts アルキル化反応の不斉触媒化を検討する。さらに、生成物の $\beta$ -ケトスルホン官能基の変換反応を組み合わせた種々の光学活性化合物の合成を検討する。特に、芳香族複素環化合物の一つであるインドール誘導体との付加体 **3** からは、胃ガン、胃潰瘍、十二指腸潰瘍等の原因となるピロリ菌に対する顕著な抗菌作用を持ち、ピロリ菌除菌新薬の候補物質として期待されているインドールマイシン **5** の合成鍵中間体 **4** ( $R^1 = \text{Me}$ ,  $R^2 = R^3 = \text{H}$ ) およびその類縁体の合成が可能になる。



受理日 2002年9月30日