



キラルリン酸を用いた不斉触媒反応の開発

有機化学およびその関連分野

研究者所属・職名 : 理学部・教授

ふりがな あきやま たかひこ

氏名 : 秋山 隆彦

主な採択課題 :

- [基盤研究\(B\)「キラルリン酸およびその誘導体を用いた不斉合成反応の新展開」\(2017-2019\)](#)
- [新学術領域研究\(研究領域提案型\)「キラルプレンステッド酸触媒の理論的制御システム設計」\(2011-2015\)](#)
- [基盤研究\(A\)「キラルリン酸を用いた不斉触媒反応の新展開」\(2020-2022\)](#)

分野 : 有機合成化学、不斉合成、有機分子触媒

キーワード : 不斉合成、有機分子触媒、キラルプレンステッド酸

課題

●なぜこの研究をおこなったのか？（研究の背景・目的）

光学活性化合物を効率良く合成する手法の開発は、有機合成化学における極めて重要な課題の一つである。我々は、(R)-ピナフトール由来のキラルリン酸がキラルプレンステッド酸として優れた不斉触媒能を有することを2004年に見出した。その後、キラルリン酸およびその誘導体を触媒として用いて、さらに優れた不斉触媒反応の開発を目指して研究を進めている。

●研究するにあたっての苦労や工夫（研究の手法）

これまで、キラルリン酸を用いた不斉触媒反応を数多く報告してきたが、初期の研究では、基質として、主に窒素上に置換基を有するイミンを用いてきた。さらに、キラルリン酸の適用範囲を拡大するために、ニトロアルケンに対するFriedel-Craftsアルキル化反応、窒素上無置換のケトイミンに対する反応、ヒドロキシ基の活性化反応、軸性不斉化合物の合成など、幅広い種類の反応の開発に取り組んだ。

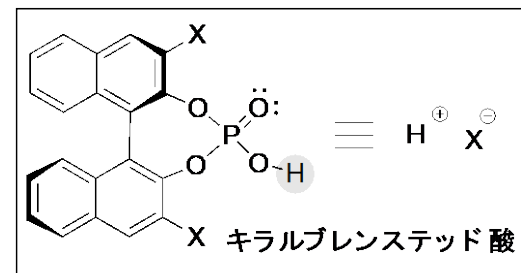


図1 キラルリン酸



キラルリン酸を用いた不斉触媒反応の開発

有機化学およびその関連分野

研究成果

●どんな成果がでたか？どんな発見があったか？

(*R*)-BINOL由来キラルリン酸およびキラルブレンステッド酸触媒として用いることにより、窒素上無置換のケトイミンに対するインドール、ピロール類のFriedel-Craftsアルキル化反応、インドリルメタノール誘導体の脱ヒドロキシ水素化反応が効率良く進行し、対応する生成物が高い光学純度で得られた。また、反応によっては、キラルリン酸は反応を触媒しないが、キラルリン酸金属塩をルイス酸触媒として用いることにより、効率良く反応が進行する。例えば、トリフルオロメチル基の置換したニトロアルケンに対するインドールのFriedel-Craftsアルキル化反応キラルリン酸カルシウム塩を用いることにより、効率よく進行した。また、軸性不斉化合物の合成や、分子内で[1,5]水素移動を伴う反応等にも展開できた。合成した化合物の例を右に示す。

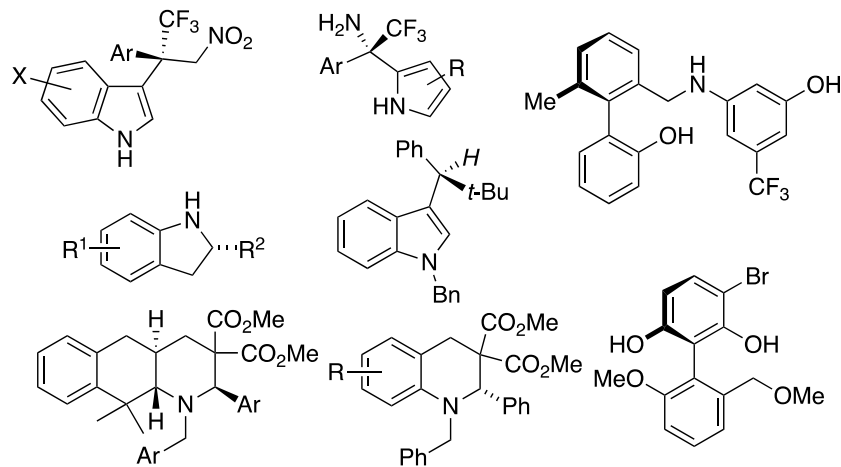


図2 合成した化合物の例

今後の展望

●今後の展望・期待される効果

キラルリン酸を用いた不斉触媒反応の開発は、世界中で数多くの研究者の間で活発な研究が行われており、キラルリン酸は非常に幅広い種類の反応を触媒することが明らかになっている。今後、実用的に用いることの可能な、新たな触媒反応の開発を目指して研究を進め、キラルブレンステッド酸触媒の分野の発展に貢献していく予定である。医薬品の製造等に用いられる反応の開発等にも取り組みたい。