

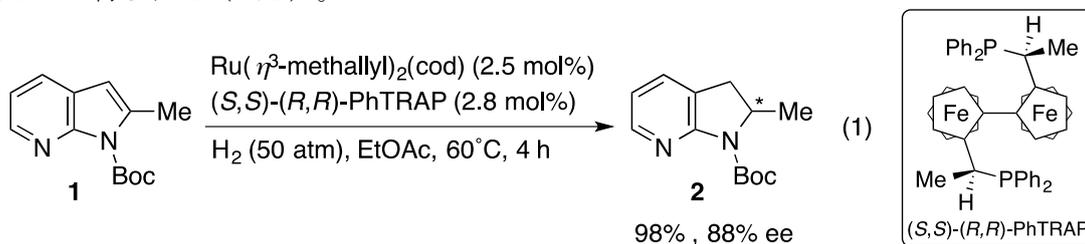
アザインドール類の触媒的不斉水素化

Catalytic Asymmetric Hydrogenation of Azaindoles

才田雅博、倉本堯弘、石塚賢太郎、榎田祐輔、桑野良一（九大院理）

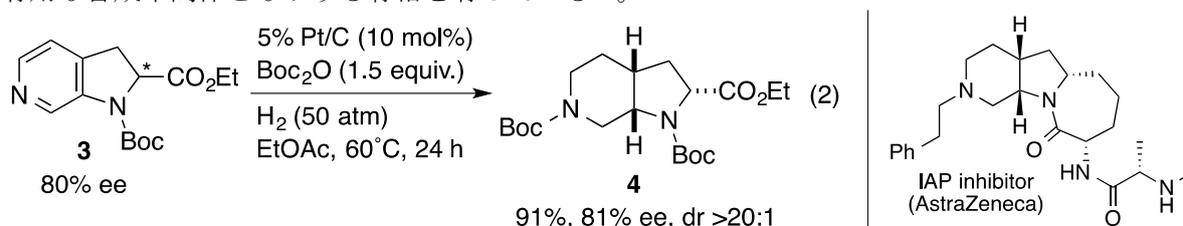
複数の複素環で構築される多環式芳香族化合物の不斉水素化は、光学活性な環状化合物に多数のヘテロ原子が導入可能であり、優れた合成手法になると期待される。実際に生理活性化合物の短段階合成に利用された例があるものの、水素化が起こる位置の選択性（化学選択性）制御の困難さからその報告は限られている。今回、PhTRAP-ルテニウム触媒を用いたアザインドール類の化学選択的かつエナンチオ選択的な水素化を開発したので報告する。

芳香族複素環の不斉水素化に有効であることが知られている種々の触媒系を用いて、ピリジンとピロールが縮環した 7-アザインドール **1** の還元を検討した結果、PhTRAP-ルテニウム触媒を用いた場合 ¹⁾ にピロール環側が還元されたアザインドリン **2** が高収率かつ高エナンチオ選択的に単一の生成物として得られた（式 1）。



本触媒系を用いることにより、様々な置換基を有する 7-, 6-, 5-, および 4-アザインドール類を不斉水素化でき、対応する光学活性アザインドリンが最高 93%ee で得られた。

さらに、光学活性アザインドリン **3** を白金-活性炭触媒により水素化すると、ピリジン部位が立体選択的に還元された（式 2）。得られたオクタヒドロアザインドール **4** は、三環性 IAP 阻害剤の有用な合成中間体となりうる骨格を有している ²⁾。



<参考文献>

- 1) Kuwano, R.; Kashiwabara, M. *Org. Lett.* **2006**, *8*, 2653.
- 2) Hird, A. W.; Aquila, B. M.; Block, M. H.; Hennessy, E. J.; Kamhi, V. M.; Omer, C. A.; Laing, N. M.; Seah, J. C.; Sha, L.; Yang, B. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2014**, *24*, 1820.

発表者紹介

氏名 才田 雅博（さいた まさひろ）
 所属 九州大学大学院理学府化学専攻
 学年 修士 2 年
 研究室 分子触媒化学研究室

