

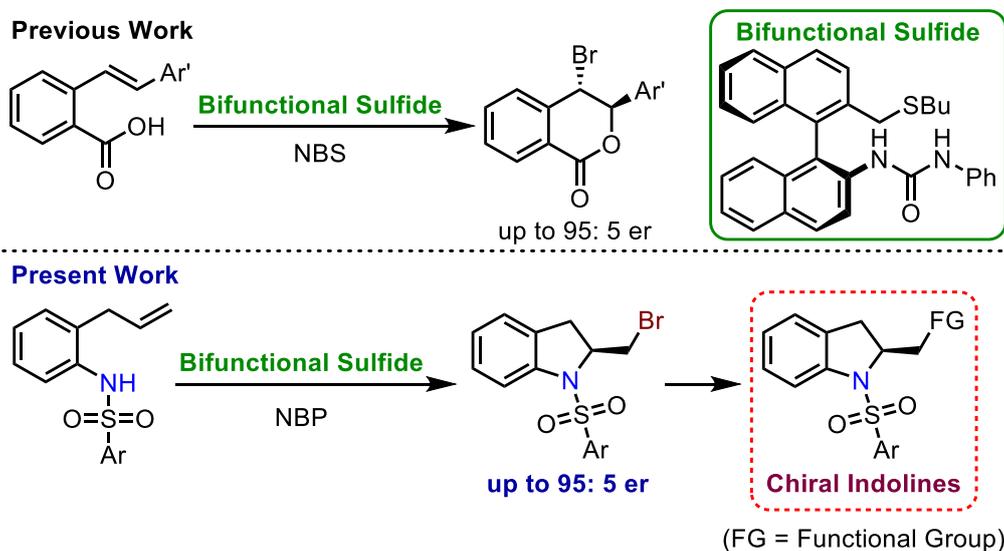


キラル二官能性スルフィド触媒を用いたブロモアミノ化反応による  
エナンチオ選択的インドリン合成  
**Enantioselective Synthesis of Indolines via Bromoaminocyclizations  
Catalyzed by Chiral Bifunctional Sulfides**

中村 巧、奥野 研、白川 誠司（長崎大院水環）

触媒的不斉ハロ環化反応は、重要な光学活性複素環式化合物を提供するため、有機合成において、最も重要な反応の一つとして認識されている。これまでに、多種多様なキラル触媒を利用した不斉ハロ環化反応が報告されているが、本反応に効果的な新規キラル触媒の開発は依然として重要な研究課題である。このような背景の中最近我々は、独自に開発したキラル二官能性スルフィド触媒を利用することにより、位置および立体選択的ブロモラクトン化反応を達成した<sup>1)</sup>。本研究では、キラル二官能性スルフィド触媒のさらなる有用性を実証するため、光学活性 2-(ブロモメチル)インドリン誘導体を提供する、2-アリルアニリン誘導体のエナンチオ選択的ブロモアミノ環化反応への適用を検討した。

ウレア部位を有するキラル二官能性スルフィド触媒を利用することにより、不斉ブロモアミノ環化反応が効率的に進行し、2-(ブロモメチル)インドリン誘導体を高い光学純度で得ることができた<sup>2)</sup>。2-アリルアニリン誘導体の窒素上の保護基をファインチューニングすることが、高いエナンチオ選択性を獲得する上で非常に重要であった。また、得られた光学活性 2-(ブロモメチル)インドリン誘導体は、光学純度を損なうことなく様々な光学活性インドリンへと変換可能であることを明らかにした。



<参考文献>

- 1) R. Nishiyori, A. Tsuchihashi, A. Mochizuki, K. Kaneko, M. Yamanaka, S. Shirakawa, *Chem. Eur. J.* **2018**, *24*, 16747–16752.
- 2) T. Nakamura, K. Okuno, K. Kaneko, M. Yamanaka, S. Shirakawa, *Submitted*.

発表者紹介

氏名 中村 巧 (なかむら たくみ)  
所属 長崎大学大学院水産・環境科学総合研究科  
  
学年 博士前期課程 2 年  
研究室 グリーンケミストリー研究室 (白川研究室)

