

公益財団法人 立松財団 御中

様式 2021A1,A2,B

2024年 2月 10日

所属： 日本女子大学理学部化学
生命学科

氏名： 澁谷 正俊

**2021年度 助成****研究 経過 ・ 終了 報告書**

※ゴシック文字で記入下さい。

研究テーマ	ホウ素触媒を用いる水素リサイクル型分子変換反応の開発
研究の結果	<p>水素は、低炭素社会の実現に向けた新たなエネルギー源として重要性を増しており、水素を無駄なく有効利用するための方法の開発が求められている。通常、有機化合物から水素分子を脱離させる脱水素化反応では、水素分子は廃棄物として反応系外に排出される。これに対して、申請者らは、脱水素化反応によって脱離する水素分子を系外に排出させずに、分子の他の部分の必要な水素化に利用する水素リサイクル型の分子変換反応の開発を目指し研究を行った。具体的には、インドリンをアルキンに付加させるヒドロアミノ化によってN-アルケニルインドリンを調製した後、インドリン部の脱水素化によって生成する水素分子を、アルケン部に付加させる反応を検討した。その結果、トリス(ペンタフルオロフェニル)ボランを触媒とした反応において、60%程度の水素がインドリン部から脱離しアルケン部へ付加することを見出した。トリス(ペンタフルオロフェニル)ボランを触媒とした場合には、アルキンとして電子供与基が置換したアリールアセチレンを用いると比較的効率的に反応が進行するものの、電子供与基を持たないフェニルアセチレンを用いると反応効率が極めて低くなってしまうことが問題となった。これは、主にインドリンとアルキンの分子間ヒドロアミノ化反応の効率の問題であったことから、よりルイス酸性の高いホウ素触媒を用いることでより広範なアルキンに対して適用可能な反応へと改良することに成功した。基質により違いはあるものの、インドリンと比較的広範なアリールアセチレンからN-アルケニルインドリンを生成させ、60-70%程度の効率でインドリン部から生成する水素分子をアルケン部へ付加させる分子内水素移動反応が進行することを確認した。生成物であるN-アルキルインドールは、様々な生物活性化合物が知られる創薬研究上重要な化合物群である。しかしながら、インドールの直接的なN-アルキル化は、3位で進行しやすいために多段階を要することが多い。本研究で見出した、インドリンとアルキンからの分子間ヒドロアミノ化と形式的な分子内水素移動反応をへてN-アルキルインドールを合成する方法は、N-アルキルインドールのあらたな合成法と位置付けることもできる。</p>
研究発表 (実績)	<p>日本薬学会 142 年会 「ホウ素触媒を用いる形式的分子内水素移動型分子変換反応の開発」 ○鈴木信一、澁谷正俊、山本芳彦 (2022 年 3 月 オンライン)</p> <p>第 67 回 日本薬学会東海支部大会 「ホウ素触媒の特性を利用した水素リサイクル型分子変換反応の開発」 ○鈴木信一、澁谷正俊、山本芳彦 (2021 年 7 月 オンライン)</p>

提出期限：研究期間終了後、すみやかに助成金の「必要経費使途明細書」「領収書」と合わせて提出下さい。
年度をまたぐ場合は毎年3月末日までに、途中経過をご記入の上、報告願います。