

グアニジン-ウレア触媒を用いた 2-オキシインドール類の立体選択的酸化的二量体化反応の開発

(東農工大院工) ○森 偉央・杉本 幸太・小田木 陽・長澤 和夫

Development of diastereo- and enantioselective oxidative dimerization reaction of 2-oxindoles using guanidine-urea bifunctional organocatalyst (*Graduate School Faculty of Engineering, Tokyo University of Agriculture and Technology*) ○Io Mori, Kota Sugimoto, Minami Odagi, Kazuo Nagasawa

The bis-oxindole skeleton is a common structure in bispyrrolidino[2,3-b]-indoline alkaloids. In this work, we achieved an enantioselective oxidative dimerization of 2-oxindole with a substituent at C3 by using a guanidine-urea catalyst. In the presence of a guanidine-urea catalyst, the dimerization reaction proceeded with CHP as an oxidant at $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$, and the corresponding bis-oxindole was obtained in 99% yield and 98% ee (*dl:meso* = 11:1).

Keywords : Organocatalyst; Hypoiodite; Guanidine; Oxindole; Enantioselective Oxidative Dimerization

【目的】

ビスオキシインドール骨格 **2** は、Folicanthine (**1**)をはじめとするビスピロリジノ[2,3-b]-インドリンアルカロイド類に共通する構造である(Fig 1)。本研究では、グアニジン-ウレア触媒 **4**¹⁾を用いた 2-オキシインドール **3** の酸化的ホモカップリングにより、ビスオキシインドール **2** の立体選択的合成を検討した。

【方法・結果】

3 位にメチルエステルを有する 2-オキシインドール **3a** に対して、トルエン溶媒中、 $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ にてグアニジン-ウレア触媒 **4** 存在下、酸化剤として CHP を作用させたところ、目的とするビスオキシインドール **2a** が収率 99%、98% ee、(*dl:meso* = 11:1)の比で得られることを見出した(Scheme 1)。基質適用範囲についても報告する

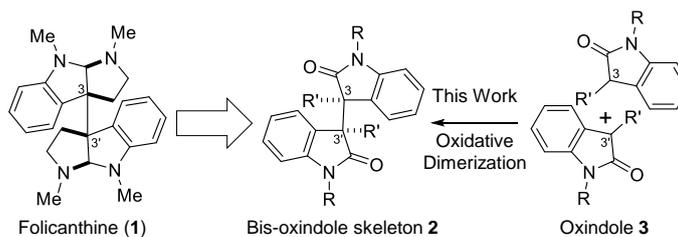
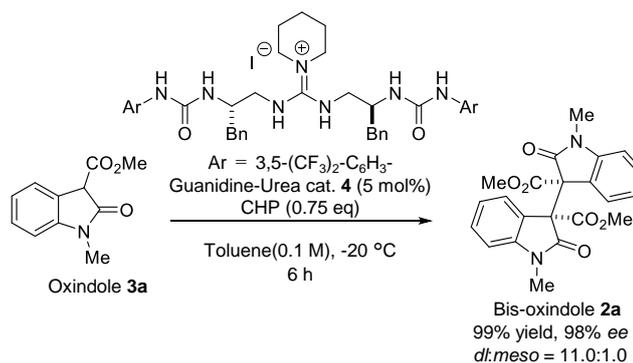


Figure 1. Bis-oxindole skeleton in natural products



Scheme 1. Diastereo- and enantioselective oxidative dimerization

1) Sohtome, Y.; Nagasawa, K. *Synlett*, **2010**, *1*, 1-22.