

### 31-0593 W66-2

有機酸を用いた多置換型シクロブタン及びシクロブテンの実用的合成法の開発  
○稲永 風人<sup>1</sup>, 高須 清誠<sup>1</sup>, 井原 正隆<sup>1</sup> (<sup>1</sup>東北大院薬)

【目的】シクロブタン及びシクロブテンは最も基本的な環構造の一つであり、重要な生理活性物質の部分構造としてもしばしば見られる。また、その固有のねじれ歪みエネルギーを利用して、環拡大反応など多くの有用な反応が知られている。しかしながら、4員環形成の実用的な合成法は限られているのが現状である。今回、我々は、有機酸である  $\text{Tf}_2\text{NH}$  を触媒に用いることで、実用的な (2+2) 環化反応を開発することを目的とする。

【結果】シリルエノールエーテル及び $\alpha,\beta$ -不飽和エステルに対し、 $\text{HNTf}_2$  を触媒量作用させると (2+2) 環化反応が効果的に進行することを見出した。本反応は、位置及び立体選択的に進行し、非常に幅広い基質に対し適用可能である。また、触媒量を最高 0.1 mol% まで減らすことが可能であり、無溶媒、AcOEt 溶媒系などでも反応は効果的に進行する。グラムスケールの合成でも高収率に目的物を与えることから大量プロセスに適用可能な合成法である。

