

30amA-631

Pd/BN 触媒によるアルキンの部分還元を鍵とする位置選択的重水素標識アルケン合成

○矢部 雄貴¹, 澤間 善成¹, 門口 泰也¹, 佐治木 弘尚¹(¹岐阜薬大)

既存医薬品の部分的な重水素変換体(ヘビードラッグ)が薬効や持続性の向上を示すため注目を集めている。官能基変換が容易なアルケンやアルキンの重水素標識体は新しい機能性物質の合成における前駆体として有用となるが、望みの位置に選択的に重水素を導入するための一般性ある手法は報告されていない。アルキンを基質とした、D₂ ガス存在下の部分還元により重水素化アルケンの合成は可能であるが、還元活性の制御や高価な重水素ガスの使用に問題が残る。一方我々は、末端アルキンからアルケンへの部分水素化に有効な窒化ホウ素(BN)担持型Pd触媒(Pd/BN)¹⁾を開発するとともに、最も安価な重水素源である D₂O を用いた常温、常圧下における効率的な D₂ ガスの調製法²⁾を確立している。今回、アルキン(**1**)および重水素標識アルキン(**1-d₁**)をそれぞれ基質として、H₂ あるいは用時調製した D₂ ガスによる Pd/BN 触媒的部分還元、すなわち、位置選択的重水素標識アルケンの合成法を確立した。本発表では、緩和な条件で進行する **1-d₁** の新規簡便合成法(Route A)を報告するとともに、位置選択的な重水素標識アルケン(**2-d_{1,3}**)の合成法(Route B-C)に関する詳細を発表する。³⁾部分還元による標識アルケンの合成では、ニトロ基やベンジルエーテルなど Pd/C 触媒等では容易に還元を受ける還元性官能基が保持される点も特徴の一つである。

1) *Adv. Synth. Catal.* **2012**, *354*, 1264.

2) *Chem. Eur. J.* **2008**, *14*, 3371. *Org. Lett.* **2004**, *6*, 3521.

3) *Chem. Eur. J.* **2012**, *in press*.

