

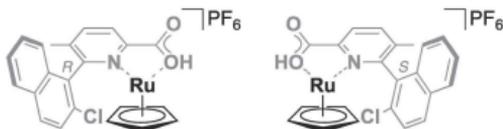
30K-am20

脱水型分子内アリル化に基づく光学活性 1,2- および 1,3-A,A (A = O or N) モジュール合成法の開発

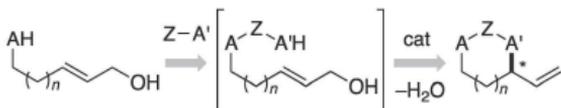
○伊代田 陽子³, 関 知昭³, 田中 慎二², 北村 雅人¹ (1名大院創薬, 2名大物質国際研, 3名大院理)

【目的】ポリオール、ポリアミン、ポリアミノアルコール類は生物活性物質の部分構造として広く組み入れられている。それらの合成においては、ヒドロキシ基やアミノ基の位置および立体選択的な導入が重要課題であり、汎用性の高い構築法が求められている。本研究では、独自に開発した脱水型アリル化触媒反応を基盤に様々な骨格に対応した系統的なモジュール合成法の確立を目指す。

【実験】図に示した CpRu/Cl-Naph-PyCOOH 触媒を用いると、分子内にヒドロキシ基やアシルアミノ基をもつアリルアルコールを、対応する α アルケニルエーテルや環状アミドへと脱水的に変換できる。反応性、エナンチオ選択性ともに高い。本触媒法を用いて問題解決にあたる。具体的には、アリルアルコールに連結した官能基 AH (A = O or NR) に、除去可能な架橋部 Z を介して A'H を導入し、エナンチオ選択的な A'-アリル結合形成により、 α アルケニル環化体へと変換する。Z を除去すれば 1,*n* (*n* = 0 or 1)-A,A モジュールが得られ、アルケニル基をアリルアルコールに変換すればこのプロセスの繰り返しによる連続的な骨格構築も可能となる。目的達成に向けて、架橋部 Z の構造および各種モジュール合成への適用性を調査する。



CpRu/Cl-Naph-PyCOOH



A, A' = O or NR, *n* = 0 or 1