

29pmM-006S

第3級アルコールの Williamson 型エーテル環化反応と Gymnocin-A の KLMN フラグメント合成

浅野 晴日¹, ○谷本 美樹¹, 安西 志織¹, 坂井 健男¹, 森 裕二¹ (¹名城大薬)

【目的】第3級アルコールは、その嵩高さゆえ求核置換反応を起こしにくいとされている。今回、Gymnocin-A の KLMN フラグメント合成においてヒドロキシプロモケトンの第3級アルコールの分子内求核置換反応の条件の詳細な検討を行ったので報告する。

【方法・結果】プロモケトン **1** の環化において、塩基を種々検討したところ、NaH や DBU では目的物をほとんど得ることが出来なかったが、NaOH/THF 系が環化を促進することが明らかになった。しかし、大量スケールでは、2相系のためか大幅に反応速度が低下した。そこで 18-crown-6 を添加すると、反応速度が向上し、8時間後 88%の収率で環化体 **2** を得ることに成功した。

その後、**2** より 10 工程を経て、KLMN 環フラグメント **4** 合成を達成した。

