

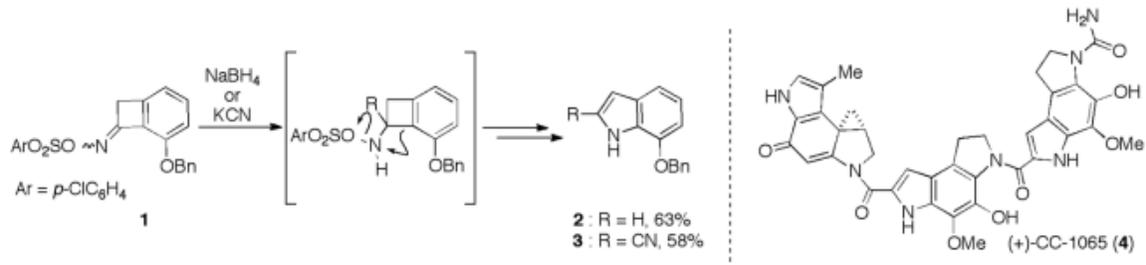
29K-pm01S

オキシムスルホナートの新規環拡大反応の開発とその応用

中沢 佑起¹, ○今泉 拓¹, 岡野 健太郎¹, 坂田 樹理¹, 徳山 英利¹ (¹東北大院薬)

【背景・目的】当研究グループは、DIBALH を用いたオキシムの還元的環拡大反応を利用し、多様な環状アミンの合成を行ってきた¹⁾。しかしながら、本反応には、オキシムの活性化のために過剰量の DIBALH が必要であり、官能基共存性等に問題を残していた。そこで、オキシムをあらかじめオキシムスルホナートとして活性化することにより、温和な条件で求核剤が付加した後に、同様の環拡大反応が進行すると考え、研究を行った。

【方法・結果】検討の結果、ベンゾシクロブテノンより誘導した、オキシムスルホナート **1** に対し、水素化ホウ素ナトリウムを作用させると、期待した環拡大反応が首尾よく進行し、インドール **2** が得られた(63%)。さらに、求核剤として、シアン化カリウムを用いた結果、2-シアノインドール **3** が得られた(58%)。現在、本環拡大反応を鍵反応に用いた CC-1065(**4**)の全合成を検討中である。



【参考文献】 1) Cho, H.; Iwama, Y.; Sugimoto, K.; Mori, S.; Tokuyama, H. *J. Org. Chem.* **2010**, *75*, 627.