

# 28PA-am008

para-ビニリデンキノンメチド中間体を経由する 3, 4 位縮環 2-ヒドロキシアリールジヒドロベンゾピラン類の合成法開発

○崔 東一<sup>1</sup>, 滋賀 直樹<sup>1</sup>, Robert FRANZEN<sup>1</sup>, 根本 哲宏<sup>1</sup> (<sup>1</sup>千葉大院薬)

【目的・方法】フラバン骨格を有する化合物は天然に広く存在しており、その様々な生物活性ゆえ、古くから創薬への研究が行われてきた。特に化合物 **4** のような 3, 4 位縮環 2-ヒドロキシアリールジヒドロベンゾピラン類は、エストロゲン受容体  $\beta$  アゴニストとして知られており、芳香環上の水酸基の位置及びピラン環上の 2, 3, 4 位の置換様式がその活性の鍵を担っていることが報告されている。

当研究室では、酸プロモーターによるフェノール類の脱芳香化とそれに続くカスケード反応により、合成容易な分子から複雑骨格の縮環分子へ一挙に導く種々の合成法を開発してきた。今回、アルキニルフェノール類の脱芳香化で生成する *para*-ビニリデンキノンメチド中間体を用いることで、ジヒドロベンゾピラン類の新規合成法が開発できると考え研究に着手した。

【結果】フェノール誘導体 **1** に対し種々の反応条件の検討を行った結果、ジヒドロベンゾピラン **4** を単工程で構築する条件を見出した。またエストロゲン受容体  $\beta$  選択性に関わる 2, 3-*syn* 及び 3, 4-*syn* の立体制御も達成出来た。基質一般性についても併せて報告する。

