

7 光を駆動力とする新規環状骨格構築手法の開発

草間 博之

本研究は、医薬品等生理活性物質などの基本構造単位として重要な環状骨格を高効率的に合成可能な独創的方法論の開発を目指し、高反応性化学種である「カルベン」を光的作用によって発生可能なアシルシランを合成素子として活用する新規分子変換手法の開拓を行ったものである。

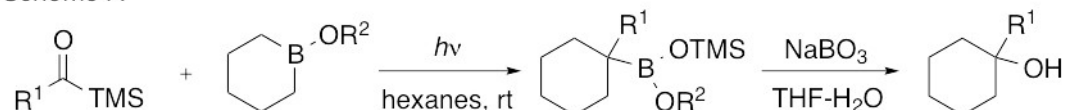
既に我々は、アシルシランの光異性化で生じたシロキシカルベンが、室温・中性条件下で有機ボロン酸エステルと効率的に分子間カップリングを起こすことを見出していたが、本研究において、この反応を基盤とした環状骨格形成手法の開発を目指した検討を行ったところ、ボロン酸エステルに代えて環状ボリン酸エステルを基質として用いると、対応する炭素環が簡便に合成できることを見出した (Scheme A)。本手法は多様な炭素環状化合物を合成するための有用な手法になり得ると考えている。

またシロキシカルベンを反応活性種とする分子内 C-H 結合挿入反応についても検討を実施し、ベンゾフラン誘導体を簡便かつ立体選択的に合成可能な新手法の開拓にも成功した (Scheme B)。

これらの成果は、外部反応剤を必要とせず、光的作用により実施可能なクリーンな環状骨格構築手法であり、今後の研究展開により、多様な環状化合物を高効率的に合成可能な実用的手法へと発展可能と期待している。

アシルシランの光反応を利用した環状骨格構築手法

Scheme A



Scheme B

