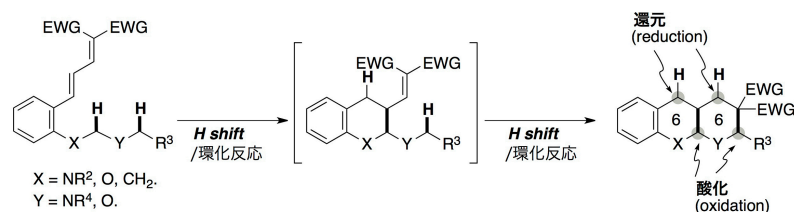


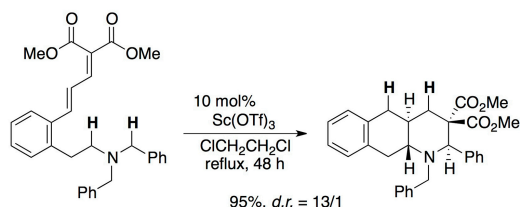
105 酸化還元を利用する多重 C(sp³)-H 結合変換法の開発

森 啓二

環境問題が大きく取りざたされる現在、環境に優しい分子変換法への需要が急速に高まっている。その中でも、様々な化合物中に偏在する炭素-水素結合を直接変換する C-H 結合官能基化法は、ハロゲン化などの事前の基質調製を必要とせず、また余分な廃棄物を出さない有用な合成法の一つである。本研究では近年我々が開発した分子内のヒドリド転位に基づく環境調和型 C-H 結合官能基化法（「分子内 redox 反応」）の連続利用による多重 C(sp³)-H 結合官能基化反応の開発を目指し、研究に取り組んだ。その結果、反応性の高いシンナミリデンバルビツレートを用いることで望みの二重 C(sp³)-H 結合官能基化反応が効率よく進行することを見出した。ドーパミン受容体アゴニストの母核となる多置換オクタヒドロベンゾキノリン骨格を単工程で与える有用な合成反応である。残念ながら、そのジアステレオ選択性は低い値にとどまったが、求電子部位をマロナートに変更することで極めて高いジアステレオ選択性を達成できた。さらに本二重 C(sp³)-H 結合官能基化が、酸素誘導体を用いた多置換ピラン誘導体の高ジアステレオ選択的合成にも展開できることも明らかとした。

分子内 redox 反応を駆使する二重 C(sp³)-H 結合官能基化反応の開発

【三環性多置換ペリジンを合成】



【三環性多置換ピラン合成】

