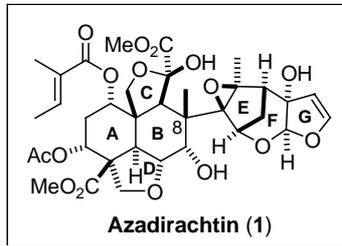


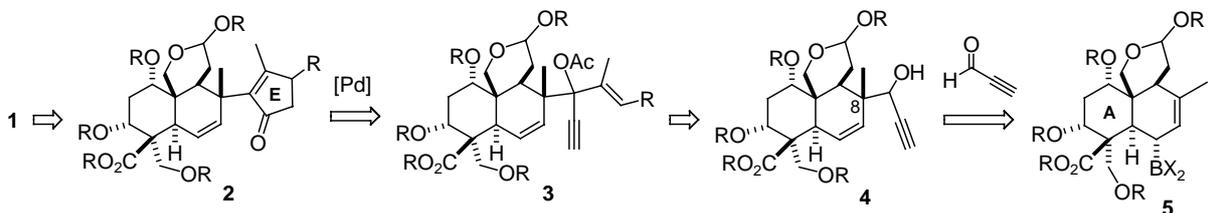
アザジラクチンの全合成研究

(北大院理¹、工学院大工²) 中川 大輔¹・逢阪 修平¹・宮下 正昭²・谷野 圭持¹

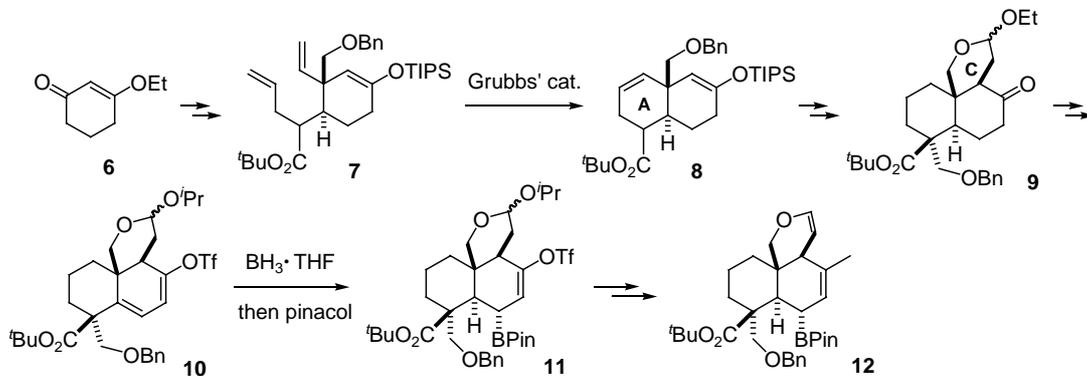


アザジラクチン(1)は熱帯植物インドセンダンより単離された昆虫摂食阻害物質であり、国内外で活発に合成研究が行なわれている。我々は、アリルボランとアルデヒドの分子間付加反応により高度に混み合った環境にある C8 位四級不斉炭素を構築する新たな合成戦略を立案した。すなわち、鍵中間体 2 をエンイン 3 の

Nazarov 環化反応により合成することとし、基質 3 の前駆体アルコール 4 の合成にアリルボラン 5 とアルデヒドの付加反応を用いる計画である。



まず、アリルボラン 5 の A 環を簡略化したモデル化合物の合成を行なった。市販のエノン 6 から合成したトリエン 7 の閉環メタセシス反応により A 環を構築後、6 工程で三環性ケトン 9 に誘導した。9 をジエノールトリフラート 10 へ変換後、位置および立体選択的ヒドロホウ素化反応とクロスカップリング反応を経てアリルボラン 12 を合成した。



本合成計画の鍵となるアリルボラン 12 とアルデヒド 13 の付加反応は室温で速やかに進行し、プロパルギルアルコール 14 が単一の立体異性体として得られた。14 をエンイン 15 へ変換後、Nazarov 環化反応により環化体 16 を合成した。現在、FG 環部の構築を検討中である。

