

# 塩基触媒 Diels-Alder 反応を用いた生理活性化合物の効率的合成法の開発

## Efficient Synthesis of Biologically Active Compounds Using Base-catalyzed Diels-Alder Reactions

瀬座義哉、岡村浩昭 (鹿児島大理)

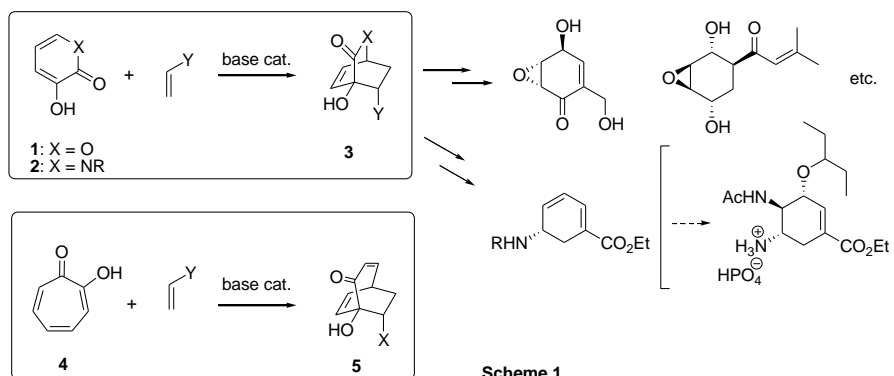
Yoshiya Seza, and Hiroaki Okamura

(Faculty of Science, Kagoshima University)

Diels-Alder (DA) 反応は、立体特異的かつ立体選択的に炭素-炭素結合を作り出すことができる重要な有機化学反応である。特に、選択性の高い触媒的 DA 反応は合成化学的に魅力的な反応であり、全合成などへの応用例も多い。現在までにさまざまな触媒が開発されているが、そのほとんどは Lewis 酸であり、ジエノフィルの活性化によって反応が制御されている。

当研究室では、塩基を触媒としてジエンを活性化する珍しいタイプの DA 反応の開発を行っており、これまでに Scheme 1 に示すような反応系を見出している<sup>1)</sup>。中でも、3-ヒドロキシ-2-ピロン (**1**) は反応性が高く、光学活性な触媒もしくはジエノフィルと組み合わせることによってエナンチオ選択的に生成物を得ることができる<sup>1a</sup>。この反応を利用して、シクロヘキセンオキシド類やカルバ糖類などの効率的なエナンチオ選択的合成を達成した<sup>2a</sup>。また、3-ヒドロキシ-2-ピリドン (**2**) の塩基触媒 DA 反応は含窒素シクロヘキセン環を合成するための有用な方法であり、これを用いてインフルエンザ治療薬タミフルの合成中間体の短段階合成法を開発した<sup>2b</sup>。

現在、**1**、**2** および **4** を用いた新しいエナンチオ選択的塩基触媒 DA 反応の開発と、これを利用した生理活性カルバ糖類の一般的な合成法の開発を検討中である。



### <参考文献>

- 1) a) Okamura, H.; Morishige, K.; Iwagawa, T.; Nakatani, M. *Tetrahedron Lett.* **1998**, 39, 1211. b) Okamura, H.; Nagaike, H.; Iwagawa, T.; Nakatani, M. *Tetrahedron Lett.* **2000**, 41, 8317. c) Okamura, H.; Iiji, H.; Hamada, T.; Iwagawa, T.; Furuno, H. *Tetrahedron* **2009**, 65, 10709.
- 2) a) Okamura, H.; Shimizu, H.; Yamashita, N.; Iwagawa, T.; Nakatani, M. *Tetrahedron* **2003**, 59, 10159. b) Kipassa, N. T.; Okamura, H.; Kina, K.; Hamada, T.; Iwagawa, T. *Org. Lett.* **2008**, 10, 815.

### 発表者紹介

氏名 瀬座 義哉 (せざ よしや)  
所属 鹿児島大学大学院理工学研究科  
生命化学専攻  
学年 M2  
研究室 有機生化学講座 岡村研究室  
E-mail k7268926@kadai.jp

