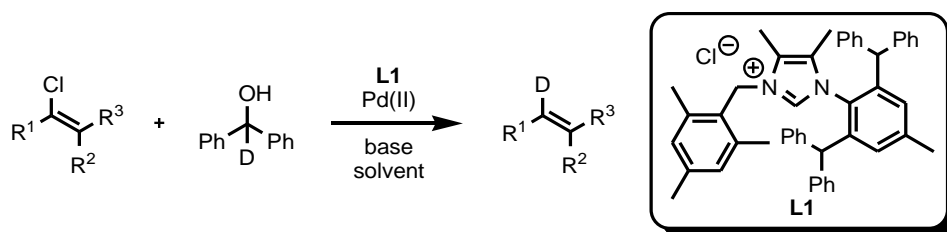




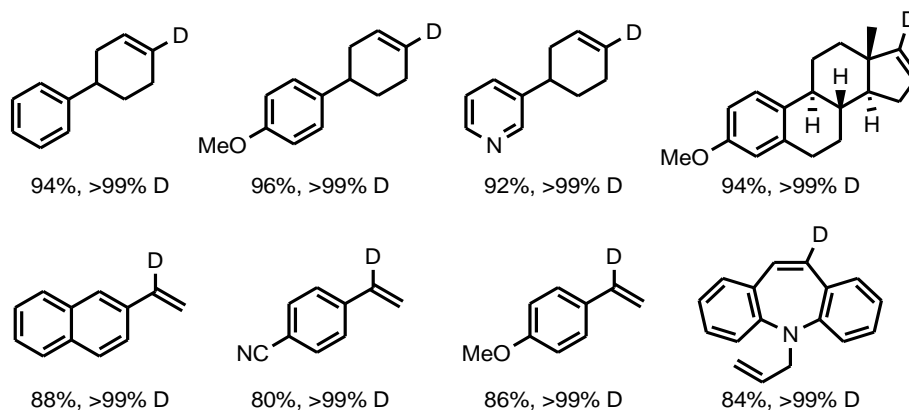
パラジウム触媒を用いた塩化アルケニルの重水素化法の開発 Palladium-Catalyzed Synthesis of Deuterated Alkenes through Deuterodechlorination of Alkenyl Chlorides

木場 広智、矢野 玄馬、森本 哲郎、栗山 正巳、
山本 耕介、尾野村 治 (長崎大院医歯薬)

重水素は薬物動態解析の標識用元素として有用であるだけでなく、近年では医薬品に重水素を導入すると生物活性や薬物相互作用を制御する効果があるとして注目を集めている¹⁾。芳香環炭素への重水素導入は様々な手法が研究されているが²⁾、アルケニル型 sp^2 炭素を効率的かつ選択的に重水素化できる反応は少ない。当研究室では、新規 NHC 配位子前駆体の開発に取り組み、そのパラジウム錯体が種々の反応に対して優れた触媒性能を示すことを見いだしてきた³⁾。これまでに蓄積した NHC-Pd 触媒に関する知見を基盤として、 β -水素脱離を経由した触媒的還元法を用いることにより選択的かつ高効率に官能基共存性の高い塩化アルケニルの重水素化が可能になるものと期待し、そのような還元的手法の開発に着手した。



当初シクロヘキセン型化合物を用いて反応条件の最適化を行い、その後スチレン型塩化物への適用を検討した。スチレン型化合物は重合などの副反応が予想されたが、反応条件を調節することにより良好な収率及び重水素化率で目的の重水素化体を得ることに成功した。本発表では反応条件最適化および基質適用範囲の検討の詳細について報告する。



<参考文献>

- 1) Sanderson, K. *Nature* **2009**, 458, 269.
- 2) Kuriyama, M.; Hamaguchi, N.; Yano, G.; Tsukuda, K.; Sato, K.; Onomura, O. *J. Org. Chem.* **2016**, 81, 8934-8946.
- 3) Kuriyama, M.; Matsuo, S.; Shinozawa, M.; Onomura, O. *Org. Lett.* **2013**, 15, 2716-2719.

発表者紹介

氏名 木場 広智 (きば ひろとし)
所属 長崎大学大学院医歯薬学総合研究科
学年 博士前期課程 2 年
研究室 医薬品合成化学研究室 (尾野村研究室)

