

プロセス化学を指向する，メシルクロリド (MsCl)

– *N*-メチルイミダゾール (NMI) – Et₃N 反応剤を用いる

アシル化の開発

関西学院大学大学院理工学研究科

化学専攻 田辺研究室 山本 歩

本論文は 2 章からなる。

(1) プロセス化学を指向する，メシルクロリド (MsCl)–*N*-メチルイミダゾール (NMI)–Et₃N 反応剤を用いるエステル化・アミド化の開発：

エステル化・アミド化は，医農薬などのファインケミカルズの合成において汎用されており，これまでに多くの研究がなされてきたが，よりプロセス化学的に優れた手法の開発は強く望まれている．筆者はスルホニルクロリドの中で最も安価で低分子量である MsCl と混合アミンを縮合剤として用いる，エステル化，アミド化の開発した．同手法では，当量同士の求電子剤と求核剤を用い，高収率で目的のエステル・アミドを与える．実施例は，39 におよび基質一般性も高く，また実際の農薬や医薬中間体の合成段階への応用にも成功している．

(2) メタルフリー Claisen 型縮合反応の開発：

β-ケトカルボニル化合物は，医農薬・天然物の基本骨格や中間体に多く含有されており，その合成法の開発は重要である．(1) の研究過程においてモル比を調整することで，β-ケトカルボニル化合物が主生成物として得られることを見出した．このようなメタルフリー合成法の例は非常に少なく，また，1 ポットでの報告は無いといって良い．筆者は，酸クロリドまたはカルボン酸と縮合剤を基質とし，2 種の異なるアミン間のシナジー効果を用いる，メタルフリーの温和な条件下，1 ポットでの自己縮合型，交差型の β-ケトカルボニル化合物の合成を検討した．その結果，酸クロリド，カルボン酸の基質一般性に課題を残しているが，種々の求核剤に対して，目的の β-ケトカルボニル化合物を得ることに成功した．同研究では，NMI 特有の新たな反応開発の可能性を示した．