

可視光とホウ素を用いたニトロアレーン変換法の開発と応用

代表研究者 岡村 俊孝
慶應義塾大学 理工学部 応用化学科 助教

研究要旨

ニトロアレーンは、最も入手容易な出発原料の一つである。ニトロアレーンをアニリンへと変換後、窒素上が官能基化されたアニリン誘導体やヘテロ芳香族へと導く手法は、医薬品や農薬合成に広く利用される。一方で、ニトロアレーンのアニリンへの変換は、高温・高圧条件を用いるため環境調和性に優れない。また、ニトロ基の低反応性が原因で、ニトロアレーンを 1 工程でアニリン誘導体などへ変換する手法は、現在の有機合成でも挑戦的な課題である。

そこで我々は、ニトロアレーンの光励起により生じるビラジカルに着目した。光は、無尽蔵に太陽より得られる持続可能なエネルギーである。このビラジカルは、その不安定性から有機合成への適用は限定的だが、水素移動反応により、制御可能な反応種であるニトロソアレーンへと変換できる。本研究では、光励起と水素移動反応により生じたニトロソアレーンを、ジエンとのニトロソ Diels-Alder 反応により、多様な誘導体へと合成可能なオキサジンへと変換する手法を開発した。開発した条件は高い官能基許容性を有し、30 種類以上のオキサジンの合成に成功した。また、1g 以上のオキサジンを容易に合成可能であり、実践的な手法であることを証明した。