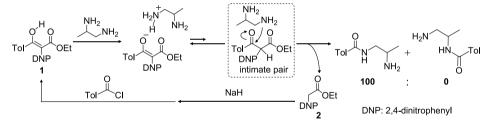
擬似分子内反応を用いた選択的アシル基交換反応の開発

Shibauchi, Hiroshi

1150228 柴内

Development of Selective Transacylation by the Pseudo-Intramolecular Process

アシル化反応は有機化学における基本的な反応であるが、酸ハロゲン化物などのアシル化剤を用いた場合、反応性が高いためにその利用に制限があることも多い。そこで、擬似分子内反応の概念を用いて穏和な条件下で位置選択的あるいは化学選択的に進行する高効率なアシル化反応の検討を行った。



2つのアミノ基を有する 1,2-プロパンジアミンを p-トルオイルクロリドでアシル化した場合、アミノ基の環境の違いを識別することができず、2種類の酸アミドが低い選択性および低収率で得られた。一方、 α 位にアリール基を導入したケトエステル 1 を用いたところ、立体障害の有無を正確に識別し内部のアミノ基を保護することなく末端アミノ基のみを選択的かつ定量的にアシル化することに成功した。また、副生成物として得られる脱アシル化体 2 はアシル基を導入することにより、再びアシル化剤と

して利用することが出来ることからアトムエコノミーの高い反応であると言える。