

ボールミルによる無溶媒有機合成反応：トレハロースのベンジリデン保護の反応条件検討

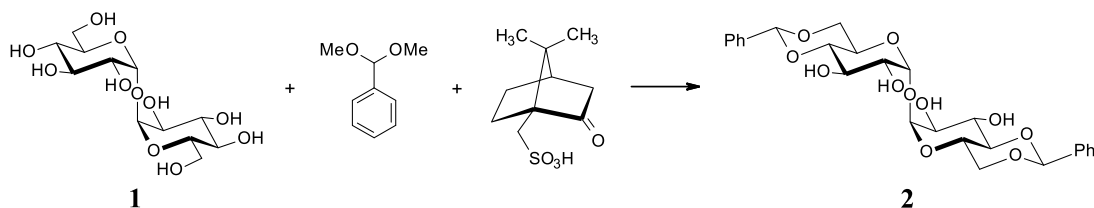
(愛知教育大学) ○新家 誠・佐藤 康太・中野 博文

Solvent-Free Organic Synthesis by Ball Mill: Investigation of Reaction Conditions for Benzylidene Protection of Trehalose (*Aichi University of Education*) ○Makoto Shinya, Kota Sato, Hirofumi Nakano

Our laboratory had designed monosaccharide derivatives that were inhibitors of infection against Japanese encephalitis virus and synthesized artificial low-molecular-weight sugar derivatives with low cytotoxicity and high activity. In this study, we focused on trehalose, a disaccharide, and investigated the synthesis of sulfated trehalose derivative with the inhibitory effect. Here, the results of actual experiments conducted in our laboratory had shown that benzylidene protection of trehalose, the first reaction in the synthetic pathway, required a long stirring time for the reaction and had a low yield. In addition, trehalose had a problem with low solubility in organic solvents. Therefore, we focused on the grinding efficiency of the ball mill and investigated conditions such as appropriate reaction time and catalyst amount to enable short-time synthesis without solvents.

Keywords: *Trehalose; Ball Mill; Benzylidene Protection; Mechanochemical Reaction*

当研究室では、これまでに日本脳炎ウイルスに対する感染阻害剤となる単糖誘導体を設計し、低細胞毒性かつ高活性な人工低分子糖誘導体を合成してきた¹⁾。本研究では、2糖であるトレハロース (**1**) に着目し、阻害効果を持つ可能性のある硫酸化トレハロース誘導体の合成を検討した。ここで、合成経路の第一反応である **1** のベンジリデン保護は、反応に長時間の撹拌が必要であることや低収率であることが、当研究室で実際に行った実験の結果から明らかになった。また、**1** は有機溶媒に対して溶解度が低いという問題点もあった。そこで、本研究ではボールミルの粉碎効率に着目し、無溶媒での **2** の短時間合成を可能にするため、適切な反応時間や触媒量などの条件検討を行った。



1) Sakuragi, M.; Suzuki, R.; Hidari, K. I. P. J.; Yamanaka, T.; Nakano, H. *Pure and Appl. Chem.* **2017**, 89, 1251.