

新規ドミノ反応を用いる光学活性シクロペンテン誘導体の立体選択的合成

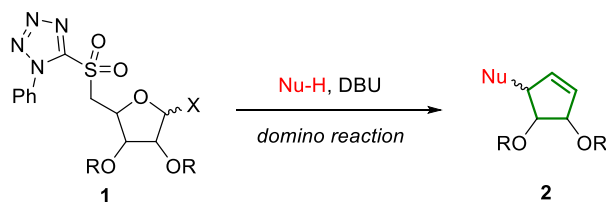
(岐阜大工¹・岐阜大 G-CHAIN²・岐阜大 iGCORE³) ○杉浦 諒¹・岡 夏央^{1,2,3}・新井 わか葉¹・古澤 実南¹・神田 万友香¹・安藤 香織¹

Stereoselective synthesis of optically active cyclopentene derivatives using a novel domino reaction (¹*Faculty of Engineering, Gifu University* ²*G-CHAIN, Gifu University*, ³*iGCORE, Gifu University*) ○Kei Sugiura,¹ Natsuhisa Oka,^{1,2,3} Wakaba Arai,¹ Minami Furuzawa,¹ Mayuka Kanda,¹ Kaori Ando¹

The Julia-Kocienski reaction gives alkenes in one step from heteroaryl sulfones and aldehydes in the presence of a base. We have found that pentose-derived Julia-Kocienski sulfones **1** bearing a leaving group and a heteroarylsulfonyl group at the 1- and 5-positions, respectively, afford cyclopentenones **2** in one step by treatment with a base and a nucleophile (Scheme 1). It is considered that the base treatment triggered a domino reaction by the α -deprotonation of the sulfonyl group, which was followed by the elimination of the leaving group and the generation of an α,β -unsaturated sulfone, the Michael addition of the nucleophile to the α,β -unsaturated sulfone, and an intramolecular Julia-Kocienski reaction. This novel domino reaction would be useful for the synthesis of optically active cyclopentene derivatives bearing the nucleophile.

Keywords : Domino reaction; Cyclopentene; Sugar; Julia-Kocienski reaction; Stereoselective

Julia-Kocienski 反応は、塩基存在下、ヘテロアリールスルホンとアルデヒドから一段階でアルケンを与える。我々は、ペントースの 1 位に脱離基、5 位にヘテロアリールスルホニル基を導入した Julia-Kocienski スルホン **1** を合成し、チオ酢酸などの求核剤の存在下、DBU と反応させることで、求核剤が導入されたシクロペンテン **2** が 1 段階で得られることを見出した (Scheme 1)。これは、スルホン α 位の脱プロトン化、1 位脱離基の脱離と α,β -不飽和スルホンの生成、求核剤の Michael 付加、分子内 Julia-Kocienski 反応が連続して起こったものと考えられる。本反応は、光学活性シクロペンテン誘導体の効率的な合成法として期待される。



Scheme 1. One-step synthesis of cyclopentene derivatives **2** from Julia-Kocienski reagents **1**.