




論文審査結果の要旨

報告番号	甲 創 第 11 号	氏 名	水口 智貴
審査委員	主 査	佐野 茂樹	
	副 査	難波 康祐	
	副 査	根本 尚夫	 印

学位論文題目

アルキニルアジリジンの 1,5-水素移動反応を鍵とする置換ピリジン及びピペリジンの選択的合成

審査結果の要旨

含窒素六員環化合物はこれまでに様々な生理活性が報告されており、天然物や医薬品にも頻繁にみられる重要な化合物群である。今回水口氏は窒素原子を含む三員環化合物であるアジリジンの特異な反応性に注目し、含窒素六員環化合物の効率的合成の開発を行った。その結果、*N*-アリールメチルアルキニルアジリジンを加熱条件下に付すことで 1,5-水素移動反応が進行しアレニルイミンを定量的かつ立体選択的に与えることを見出した。ついで、得られたアレニルイミンに対し、触媒量の PPh_3 を作用させると、アザベイリスヒルマン反応が円滑に進行しジヒドロピリジンを与えることを見出した。さらに、ジヒドロピリジンを精製することなく酢酸存在下酸化することで、三置換ピリジンが選択的に得られ、また酸素雰囲気下では四置換ピリジンが選択的に得られることを明らかにした。以上の反応開発により、多様な置換様式を持つピリジン誘導体が効率的に合成することが可能となった。

また、同じ中間体であるアレニルイミンに対し、反応試剤を触媒量の PPh_3 からピペリジンに変更することで、多置換ピペリジン誘導体を高立体選択的に与えることも見出している。

以上の知見は新規な内容を含んでおり、かつ薬学的にも重要なものである。以上の観点より本論文は博士論文として適当であると判断する。