

科目責任者 齋藤 直樹 (薬化学研究室)

## ■ 教育目的

化学合成は医薬品など有用有機分子の創製になくてはならない供給手段である。これまでにひと通り有機化学を学んだものの、個々の断片的な知識だけで、複雑な化学構造を単純な化合物から合成することは困難である。これは様々な変換過程で分子全体が高エネルギーの環境にさらされるため、用いる反応剤が変換したい官能基以外の部位にも影響を与える可能性が高いからである。本講義では、複雑な分子の合成する際に、どのような点に注意しながら計画を立てるべきか、目的を達成するにはどのような知識を習得すべきかについて実践的に学習する。

【卒業認定・学位授与の方針: SD-④, SD-⑤】

## ■ 学習到達目標

1. 医薬品の合成経路を適切に設計するために身につけるべき考え方のコツがわかる。
2. 望む反応がうまく進行しない場合、どのようにして問題を解決すればよいか、その手順を身につけることができる。
3. 反応結果を考察し、客観的に評価し、解決策を提示する力を身につけることができる。
4. ほしいものだけをつくる化学について理解を深めることができる。

## ■ 準備学習 (予習・復習)

予習: 取り上げる項目のキーワードを選定し、調査する。

復習: 演習問題を利用しながら授業プリントをまとめる

## ■ 授業内容

No.	項目	授業内容	SBO コード
1	有機合成の役割	有機合成の役割、結合の極性、反応機構の復習、ラジカル反応	
2	逆合成解析Ⅰ： 考え方と方法	1 箇所の切断でできる官能基を 1 個だけもつ化合物の合成	
3~4	逆合成解析Ⅱ： 潜在極性と官能基相互変換	2 個の官能基をもつ標的分子、1,4-ジカルボニル化合物と極性転換、環状分子の合成、官能基相互変換、ヘテロ原子を含む官能基	
5	逆合成解析Ⅲ： 戦略と計画	合成戦略と計画	
6	有機合成反応の分類	付加、脱離、置換、転位	
7,8	選択性Ⅰ： 官能基選択性と保護基	・官能基選択的反応、保護基を用いる合成 ・2つの同じ官能基のうち一方だけを反応させる方法、2 回反応する官能基	
9,10	選択性Ⅱ： 位置選択性	・アルケンの合成法、ケトンの位置選択的アルキル化 ・ $\alpha$ 、 $\beta$ -不飽和カルボニル化合物およびエポキシドへの求核剤の位置選択的付加反応	
11	選択性Ⅲ： 立体選択性	立体特異的反応、立体選択的反応	
12	分子軌道法	フロンティア軌道法	
13	ペリ環状反応 (1)	電子環状反応	
14	ペリ環状反応 (2)	Diels-Alder 反応	
15	ペリ環状反応 (3)	シグマトロピー転位	

## ■ 授業分担者

齋藤 直樹、小林 健一

## ■ 課題 (レポート、試験等) のフィードバック及び成績評価方法

期末試験 (80%)、出席状況・授業態度 (10%) および小テスト又はレポート (10%) で総合評価を行う。

## ■ 教科書

講義プリント

『有機合成の戦略』 Christine L. Willis, Martin Wills 著、富岡 清 訳 (化学同人)

## ■ 参考書

『スタンダード 薬学シリーズ 3 化学系薬学 II』

『ターゲット分子の合成と生体分子・医薬品の化学』 日本薬学会編（東京化学同人）

『ウォーレン有機化学—逆合成からのアプローチ』 S. Warren, P. Wyatt 著（東京化学同人）

## ■ その他

ペリ環状反応：第三の有機化学反応機構 I. フレミング著 化学同人