

計畫名稱：有機合成調配問題

計畫編號：NSC88-2113-M009-010

執行期限：87/8/1 – 88/7/31

計畫主持人：何子樂

執行單位：國立交通大學應用化學研究所

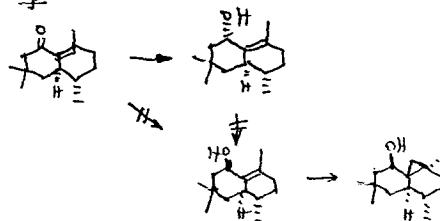
Abstract

- (1) Synthesis of the marine sesquiterpene laurobtusol has not been completed, due to the graduation of the student.
- (2) 2-Isocyanoallopupukeanane has been synthesized.
- (3) A one-step procedure for the direct conversion of trimethylsilyl ethers to carbonyl compounds by pyridinium fluorochromate has been developed.
- (4) From a common intermediate the elaboration of tavacpallescensin and occidol has been accomplished.
- (5) A report on a stereoselective synthesis of platyphyllide has been published.

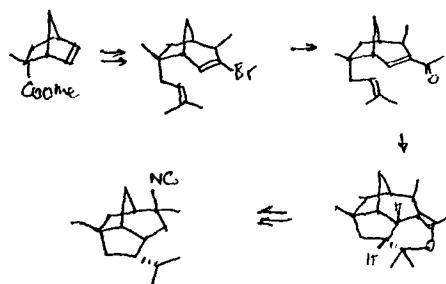
摘要

- (1) 海產倍半萜 laurobtusol 因學生畢業离去，未能完成。
- (2) 異月青海產倍半萜
2-isocyanoallopupukeanane 合成。
isocyanoneopupukeanane 合成。
- (3) 利用氟鉻酸石比啶鹽為氧化劑，同時去除矽醚保護基，以得羰基化合物。
- (4) 利用同一中間體合成
tavacpallescensin 和 occidol 之報告。
- (5) Platypyllide 立體選擇性合成報告。

(1) Laurobtusol 合成困難在於立體化學。



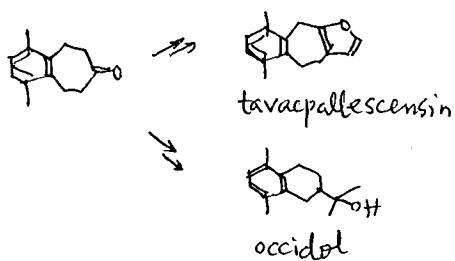
(2) 2-Isocyanoallopupukeanane 改用含溴之中間體，引進了酮基以利路易士酸催化進行分子內 ene 反應，但得到是雜 Diels-Alder 加成產物。改變步驟終於完成了合成。發表於 Org.Lett 1, 1051(1999)



上述之改變方法正是調配問題之重點。

(3) 直接把 $\text{RR}'\text{CHOSiMe}_3$ 變成 $\text{RR}'\text{C=O}$ 之反應利用 $(\text{PyH})(\text{FGrO}_3)$ 為試劑。產率 70%以上。結果發表於 J.Chi.Chem.Soc.46,639(1999)

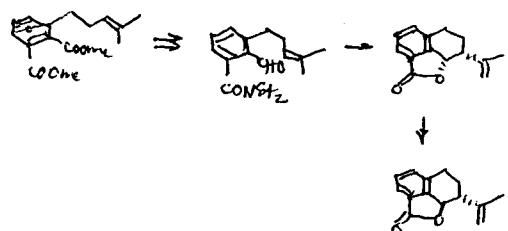
(4) 合成對稱性考量以同一中間體分別得 tavacpallescensin 及 occidol



發表於 J.Chem.Soc,1207(1999)

(5) Platiphyllide 的立體選擇性合成藉平衡異構原理以完成，又是調配問題之考量見證。

報告見 J.Chem.Soc,1823(1999)



會議報告

第 218 屆美國化學會全國會議選定在路易士安那州的奧爾良市舉行，會期為 1999 年 8 月 22 日至 26 日。雖然室外有 90° 高溫及接近 100% 濕度的環境，此次會議仍吸引了近二萬二千名參與者。跟據統計共有 5655 篇論文宣布，同時在會場的大廳有 246 家廠商展出有關化學的科技產物，其中包括電腦與書刊。在本人參加的有機化學組，論文有 653 篇，加上相關的醫藥組 322 篇，使人目不暇給。節目安排緊密，在週日清早便開始作小組分別進行討論。小組包括紀念巴頓爵士的研討會。巴頓是英國人，在 1969 年因他提出的立體化學構型分析理論，得到了諾貝爾化學獎。他在英國退休後到法國主持巴黎郊外的天然物化學研究所。多年後，在轉赴美國德州農工大學化學系，繼續展開『第三春』的研究工作。巴頓桃李盈門，是二十世

紀下半頁最有影響力的有機化學家之一，怪不得他的門人組織此一科學性紀念會，獲美國化學會贊助，共有九場演講。又此次有機組的重要節目，包括『中西香爾獎』，主題以金屬參與反應及合成，獎頒予克諾爾斯教授，他給的演說是鉛毒歷史及對策之生化。『四面體獎』今年得主二人為日本的向山光昭教授與美國的愛文斯教授，對有機合成有創意性的貢獻。向山教授是日本最盛名的有機化學家，一生從事新化學反應研究。他的小心與毅力，使領導之研究組不斷發現新而有用的合成方法。他的演講提到其中精彩片段，與及近年來合成抗癌藥物紫衫醇之努力成果。愛文斯是美國哈佛大學教授也以開創新方法馳名。

尤以不對稱合成用於複雜天然物結構，宛成一代巨匠。又頒獎節目都安排有其他著名化學家的演講，有如綠葉襯托紅花一般。另一項重要獎勵是『科普獎』。其節目佔了週二整天，從早上六場，下午四場的科普學者敘述他們的研究成果，計為

Stoddart,Saunders,Kiessling,Hamilton,Bertozzi,Ghadiu,Rich,Katzenellenbogen,Janda,Lensbury 等。這些都已成大器的人物，只未達爐火純青的階段而已。最後的科普獎得主 Hirschmann 是從默克藥廠退休，再在賓州大學研教的，一生的重要工作是在蛋白質合成上，他的言講內容，是關於利用催化抗體合成月生月大的研究情形。

值得提出的是美俄聯合討論會，以高能量有機硝基化合物之民用為主題。有六位俄國代表與會。再有紀念四面體碳原子結構理論建立 125 週年之歷史回顧會議，可惜本人無時間去聽演講。

其他一般性有機化學研究論文，分別在下列小組發表：分子辨認，物理有機，電子轉移，自由基及光化學，異向性之聚合物，晶體及液晶，碳簇化學，dendrimers，抗生素化學與細菌抗藥性，固態與液態合成方法，高經濟效能的合成技術，不對稱合成，組集式合成，複雜天然物合成，生物活性化合物，環化加成，硼參與之反應等。壁版則在週日，二，三的傍晚張貼。