

# 日本化学会賞

鈴木 章氏(北海道大学教授(工学部)理学博士)



## 〔業績〕 有機ホウ素化合物の特性を活用した 高選択的有機合成反応に関する研究

(Studies on New Synthetic Methodology by Means of Organoboron Compounds)

鈴木章氏は、有機合成中間体として有機ホウ素化合物の重要性を世界に先駆けて認識し、1965年以来、一貫して有機ホウ素化合物を用いる新規な高選択的有機合成反応に関する研究に従事し、独創的な発想と卓越した洞察力により、ユニークで極めて有用な新反応を数多く開発し、顕著な業績を挙げた。以下にその主な業績を紹介する。

### 1. 有機ホウ素化合物のマイケル型付加反応を利用する合成反応

有機ホウ素化合物は他の有機金属化合物とは異なり、アルケンやアルキン類から容易に得られること、官能基をもった有機ホウ素化合物の合成が可能であること、水に対して安定であることなどの理由により合成中間体としての利用が期待されていたにもかかわらず、C-B結合の強い共有結合性のため、有機合成への応用例が少なかった研究初期に、ホウ素原子の特性を勘案した着想をもとに、 $\alpha$ 、 $\beta$ -不飽和カルボニル化合物および関連化合物とのマイケル付加の可能性を予測し、この反応がケトン等の優れた合成法になることを初めて明らかにした。その成果は、当時ほとんど認められていなかった有機ホウ素化合物の有用性を示し、今日の隆盛を導く原動力の一つとなったことはよく知られている。

### 2. テトラオルガノホウ酸銅(Ⅰ)を利用する合成反応

1の反応は $\alpha$ 、 $\beta$ -不飽和ケトン、アルデヒド、アルドイミン類に対しては良好な結果を与えるが、同エステルやニトリル類に対しては適用できなかった。鈴木氏はこの欠点を克服する目的で広範囲な研究を行ない、メチル(トリアルキル)ホウ酸銅(Ⅰ)を用いると飛躍的に良好な結果を得ることを発見し、多くの有機化合物合成の有用な新手法になることを明らかにして注目された。

### 3. 有機ホウ素化合物の電気化学的方法を利用する合成反応

最近、有機電解法が有機合成の分野において広く検討されているが、鈴木氏は有機ホウ素化合物の電解反応を初めて試み、カップリング反応、エーテル、アセテート、ニトリル、ニトロアルカン類の合成法として応用し、価値ある知見を得ている。

### 4. 四配位ホウ素化合物を利用する合成反応

鈴木氏は当該ホウ素化合物から有機基をカルボアニオン源として利用する着想に基づき、広範な研究を行なった結果、多くの有用な新規合成反応を発見した。例えば、アルキルアジドとの反応による二級アミンの高選択的合成法や内部アルキン類の定量的合成法は、特に有名である。さらに、フェノキシ酢酸アニオンとの反応によるカルボン酸の直接合成法も、鈴木氏により、初めて報告されたものであり、その有用性は高く評価されている。

### 5. ビニル型ホウ素化合物のクロスカップリング反応を利用する合成反応

天然に存在する生理活性物質などには、各種の共役ジエン構造をもつものが多い。その代表的合成法としては、ビニル型金属化合物とビニル型ハロゲン化物とのクロスカップリングが考えられるが、金属化合物のもつ強い還元性の問題等により汎用性の広い一般的な合成法としては確立していなかった。鈴木氏は、容易に得られる(E)-および(Z)-ビニル型ボラン誘導体がパラジウム触媒と塩基の存在下、各種のビニル型ハロゲン化物と反応して、すべての型の共役ジエンをほとんど定量的収率で選択的に合成する画期的な方法を開拓し、広く注目された。

### 6. ハロボレーション反応を利用する合成反応

5の研究に関連して、鈴木氏は新しいビニル型ハロゲン化合物の合成法を開発することを目的として、1-アルキン類のハロボレーション反応を系統的に研究し、多くの新知見を発見するとともに、このハロボレーション法を初めて有機合成に利用し、顕著な成功を収めた。

以上のように、鈴木氏は有機合成化学の領域において、有機ホウ素化合物の重要性を世界に先駆けて把握し、独創的発想法に基づき多彩な研究を展開して多くの卓越した業績を挙げた。これらの成果は、海外においても極めて高く評価されている。よって同氏の業績は日本化学会賞に値するものと認められた。