

28P-am162

キラルグアニジン触媒を用いた分子内不斉マイケル反応による光学活性 2,2-ジ置換クロマン環の構築

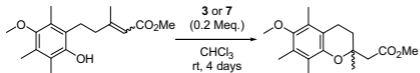
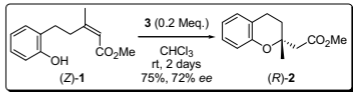
○徳能 紗也香¹, 熊本 卓哉¹, 中西 和嘉¹, 石川 勉¹ (千葉大院薬)

【目的】我々はこれまでに, methyl 5-(2-hydroxyphenyl)-3-methyl-2-pentenate (**1**) の 2,2-ジ置換クロマン **2** への分子内不斉環化反応において, キラルグアニジン **3** が有効な塩基触媒として機能することを報告している。

¹⁾ 今回我々は, 本反応の天然物合成への展開を目指し, vitamin E (**4**) のクロマン部位となる **5** の不斉合成を目的に検討を行った。

【実験・結果】芳香環上に置換基の入った (*E*)-**6**, および (*Z*)-**6** について, キラルグアニジンを用いた閉環反応の検討を行った。溶媒に CHCl₃, キラルグアニジンに **3** を用いた場合, (*E*)-**6** よりも (*Z*)-**6** でより高い不斉誘導を示した。

(*Z*)-**6** を用いて各種溶媒の検討を行ったが, CHCl₃ を凌駕する結果は得られなかった。一方, キラルグアニジンとして芳香環上に水酸基を持つ **7** を用いた場合には, 不斉誘導に変化は見られなかったものの, 化学収率が若干向上した。



(**S**)-**5** 81%, 30% ee from (**E**)-**6** and **3**
(**R**)-**5** 44%, 81% ee from (**Z**)-**6** and **3**
(**R**)-**5** 52%, 69% ee from (**Z**)-**6** and **7**

