

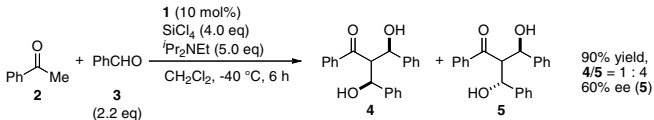
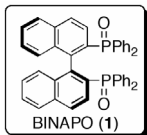
30TF-am02

キラルな Lewis 塩基触媒を用いた直接的かつ連続的アルドール反応

○下田 康嗣¹, 小谷 俊介², 杉浦 正晴¹, 中島 誠¹ (熊本大院薬,²熊本大院先端機構)

【目的】当研究室ではこれまでに、四塩化ケイ素を用いて反応系中で環状ケトン
を直接トリクロロシリルエノールエーテルに変換し、キラルな Lewis 塩基を用いて
活性化することで、エナンチオ選択的にアルドール反応が進行することを報告し
ている¹⁾。ところが、本手法をアセトフェノンに適用したところ、期待したアルド
ール付加体ではなく、低収率ながらもケトン 1 分子とアルデヒド 2 分子が連続的
に反応した付加体得られることがわかった。同様の反応を不斉触媒により行っ
た例はなく、本法の化学収率ならびに立体選択性の向上を目指し、検討を行った。

【方法・結果】-40 °Cにて、キラルな Lewis 塩基である
BINAPO(1)、ジイソプロピルエチルアミン存在下、アセトフ
ェノン(2)、ベンズアルデヒド(3)のジクロロメタン溶液に四塩
化ケイ素を添加したところ、高い化学収率かつ良好なジアス
テレオ選択性で付加体得られた。さらに、主生成物である
ジオール(5)には良好なエナンチオ選択性が観測された。本発
表では反応機構など本反応の詳細について報告する。



1) Kotani, S.; Shimoda, Y.; Sugiura, M.; Nakajima, M. *Tetrahedron Lett.* **2009**, *50*, 4602.