

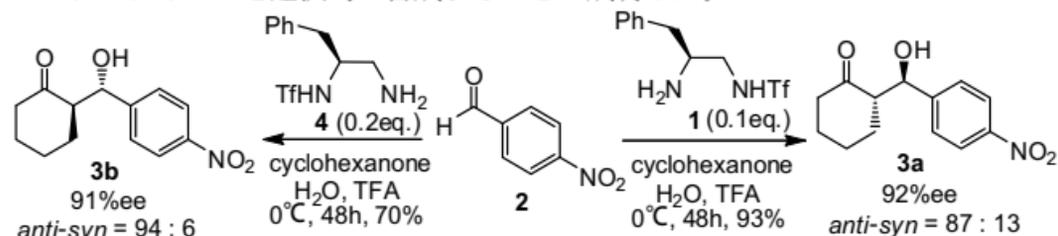
30TF-am06Q

有機分子触媒を用いた両エナンチオ選択的不斉アルドール反応

○伊奈 万里子¹, 三浦 剛¹, 今井 貴恵¹, 今井 信行², 多田 教浩¹, 伊藤 彰近¹
(¹岐阜薬大, ²千葉科学大薬)

【目的】環境に優しい有機合成化学として、有機溶媒を使用せず、水を反応溶媒として用いる不斉反応の開発が望まれている。発表者らはこれまでにフェニルアラニンから誘導したアミノスルホンアミド型触媒 **1** が brine 中でアルドール反応をエナンチオ選択的に触媒することを報告している¹⁾。今回、さらに水添加量を調節することで収率およびエナンチオ選択性が向上することを見出し、反応条件の最適化について検討を行った。また、新たに調製した有機分子触媒 **4** を用いると、**3a** のエナンチオマーである **3b** を選択的に合成できることを見出した。

【方法・結果】市販のフェニルアラニノールから 6 工程、全収率 48% でアミノスルホンアミド **1** を、33% で **4** をそれぞれ調製した。触媒 **1** と **4** を用いて、それぞれ TFA (0.05 eq.), H₂O (0.5 eq.) 存在下、*p*-nitrobenzaldehyde (**2**) を cyclohexanone (5 eq.) と 0°C で 48 時間反応させたところ、アルドール縮合体 **3a** を収率 93% (92% ee) で、**3b** を収率 70% (91% ee) で得ることができ、同一不斉源由来の触媒 **1** と **4** から両方のエナンチオマーを選択的に合成することに成功した。



【文献】 1) T. Miura, et al., *Tetrahedron Lett.*, **2009**, 50, 2632.