

28R-pm08S

キラル銅触媒を用いた不斉酸化による光学活性セリン類合成

○大山 達也¹, 栗山 正巳¹, 尾野村 治¹ (¹長崎大院医歯薬)

【目的】

α -置換セリンは、コナゲニン、ミリオシン等の生物活性化合物の構成要素であるが、非天然アミノ酸であり入手は容易ではない。これまでに α -置換- α -アミノマロン酸エステルの不斉加水分解を利用した多段階合成法が報告されているが、反応効率、選択性、基質適用性などに問題を残している。そこで、光学活性 α -置換セリン類の効率的な合成法の確立が望まれている。

【結果】

当研究室では 1,2-ジオールにキラル銅触媒が配位することにより一方の水酸基を活性化し、NBS によって選択的に酸化する方法の開発に成功している。今回、本手法を 1,3-ジオールにも適用できるのではないかと考え、プロキラルな 2-amino-1,3-propanediol を出発物とし、光学活性 α -置換セリン類合成法の開発に着手した。その結果良好な収率、エナンチオ選択性での合成に成功した。今回は本反応の最適化及び基質適応範囲について報告する。

