

28M-pm23S

触媒的アシル化による置換基を持つジオール類の Parallel Kinetic Resolution

○久米川 涼¹, 西島 秀幸¹, 吉田 圭佑¹, 今吉 亜由美¹, 上田 善弘¹, 川端 猛夫¹ (京大化研)

【目的】当研究室では求核触媒 **1** を用いる糖類の位置選択的アシル化を報告している¹⁾。本触媒はグルコース誘導体の 6 位水酸基を認識し 4 位選択的アシル化を起こす。これは本触媒が 1,3-ジオール構造とそのキラリティ特異的に認識すること由来すると考えられる。一方、触媒 **2** は NsNH 基を認識し、その窒素原子から 4 炭素離れた炭素の水酸基に選択的なアシル化を起こす特性を持つ²⁾。これら両方の構造的特徴を併せ持つ基質 **3** (R=H) では高度な Parallel Kinetic Resolution (PKR) が進行することを第 134 回年会で報告した³⁾。今回、置換基 R (R≠H) を持つジオール体について本 PKR の一般性を検討した。

【結果と考察】ラセミ体 **3a** (R = Me) を触媒 **1** 存在下、無水酢酸と反応させると、片方のエナンチオマーは第二級アシル化体 **4a** (97 %ee, 34% yield) を与えたのに対し、もう一方は第一級アシル化体 **5a** (75 %ee, 51% yield) をそれぞれ選択的に与え、PKR が観察された。C3 位に種々のアルキル基を有する基質 **3b-f** についても同様に PKR が進行した。

1) Kawabata, T. *et al. J. Am. Chem. Soc.* **2007**, *129*, 12890.

2) Kawabata, T. *et al. Chem. Commun.* **2012**, *48*, 6981.

3) 日本薬学会第 134 回年会要旨集 **2014**, *2*, 134.

