

## キラル有機分子触媒のデザインと有用アミノ酸の実用的不斉合成

## Design of Chiral Organocatalysts for Practical Synthesis of Useful Amino Acids

丸岡 啓二

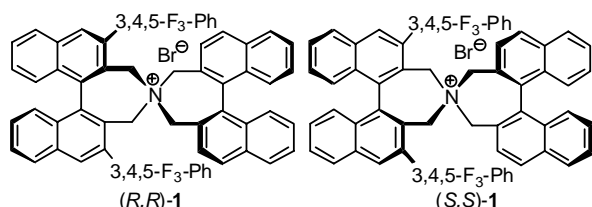
Keiji Maruoka, Department of Chemistry, Graduate School Of Science, Kyoto University

606-8502 京都市左京区北白川追分町, 京都大学大学院理学研究科化学専攻

Tel:075-753-4041, Fax:075-753-4041, E-mail:maruoka@kuchem.kyoto-u.ac.jp

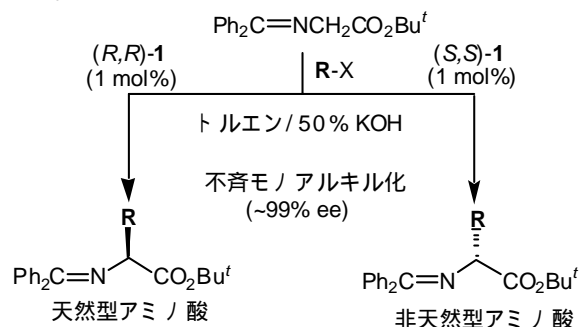
The design of new catalysts and new reactions in an environmentally benign manner is increasingly important in this century for the construction of new and useful organic molecules. Accordingly, we have developed new, practical asymmetric methodologies based on the design of environmentally benign chiral phase-transfer catalysts and chiral binaphthyl-modified amine catalysts as chiral organocatalysts, which were derived from readily available optically pure binaphthols.

近年、地球規模で広がる環境への負荷をできるだけ軽減し、いわゆる地球環境に優しい化学合成や環境に優しい分子・反応の設計を目指してより良い環境を作るためにグリーンケミストリーへの取り組みが進んでいる。この観点から、私どもは環境調和型のキラル有機分子触媒のデザインに取り組み、有用アミノ酸の実用的不斉合成など、地球環境にやさしい無公害型の有機合成反応プロセスの開拓を目指した。

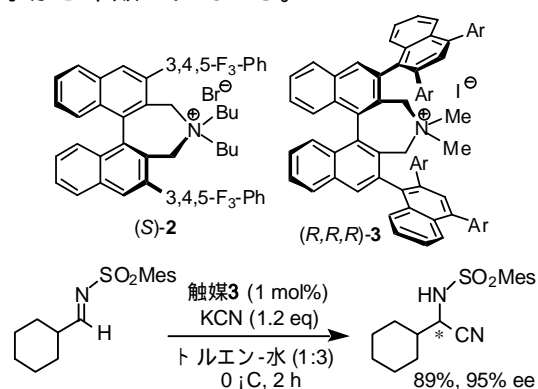


有機分子触媒が水と有機溶媒の間を行き来する相間移動反応は、水溶液中、常温、常圧、開放系で行なえるため、極めて工業化しやすい反応システムである。しかも、金属を使わない相間移動触媒を用いるため、地球環境に調和した有機合成反応プロセスが可能になる。私どもは、市販の安価な光学活性ピナフトール由来のスピロ型キラル相間移動触媒 1 を考案し、これを用いて有用物質の触媒的不斉合成、とくに天然型及び非天然型の有用アミノ酸やペプチドの実用的な大規模入手プロセスを確立した。本法により、各種の生理活性アミノ酸が容易に合成できるばかりか、既存の工業的方法では入手しにくい各種の人工アミノ酸の大量合成が可能になった。また、先例のない不斉二重アルキル化反応の開発により、従来至難とされていた、 $\alpha,\beta$ -ジア

ルキルアミノ酸の触媒的合成プロセスが確立できた。



さらに構造の単純化と併せて、極めて高活性のキラル相間移動触媒 2 (基質のわずか一万分の 1 の量) を開発することに成功し、現在、関東化学から市販されている。



このようなキラル相間移動触媒を用いた人工アミノ酸合成の唯一の泣き所は、かさ高い人工アミノ酸が合成しにくい点である。そこで、不斉ストレッカー反応に有効なキラル有機分子触媒を新たにデザインし、らせん型のキラル相間移動触媒 3 が極めて良い結果を与えることを見いだした。