

ラセミ体のアミノ酸を光学活性なアミノ酸エステルへと変換する新規手法の発明

Nonenzymatic, Enantioconvergent Dynamic Kinetic Resolution (DKR) of Racemic 2-(H-Pyrrol-1-yl)alkanoic Acids as α -Amino Acid Equivalents

教授 椎名 勇
Prof. Isamu SHIINA

東京理科大学 理学部第一部応用化学科
Department of Applied Chemistry, Faculty of Science Division I
Tokyo University of Science

椎名研究室の研究内容の紹介

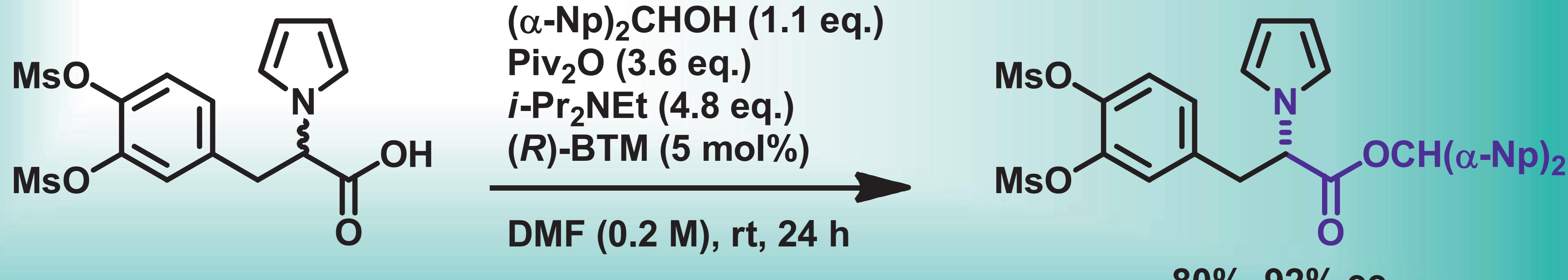
光学活性なカルボン酸およびカルボン酸エステルは医薬品や機能性材料の主骨格を成す基本構造である。しかしながら、安価なラセミ体を原料とし、簡便な操作で光学活性体を与える手法はこれまでほとんど知られていなかった。

近年、我々の研究室ではラセミカルボン酸の一方のエナンチオマーを選択的にアルコールと縮合させる不斉エステル化反応を開発した。しかし上記手法では、各々のエナンチオマーの最高収率が原理的に50%であるため、より有効な反応の創出が求められた。そこで反応条件を改めて詳細に検討することで原料のカルボン酸が反応系内でラセミ化する現象を発見し、不斉エステル化反応と組み合わせることで光学活性エステルを100%に近い収率で与える“動的速度論的光学分割反応(DKR)”を確立した。

今回我々は、ラセミ α -アミノカルボン酸等価体を本反応に適用することでDKRを実施し、良好な選択性で光学活性アミノ酸保護体を与える新規合成法を発明したので報告する。

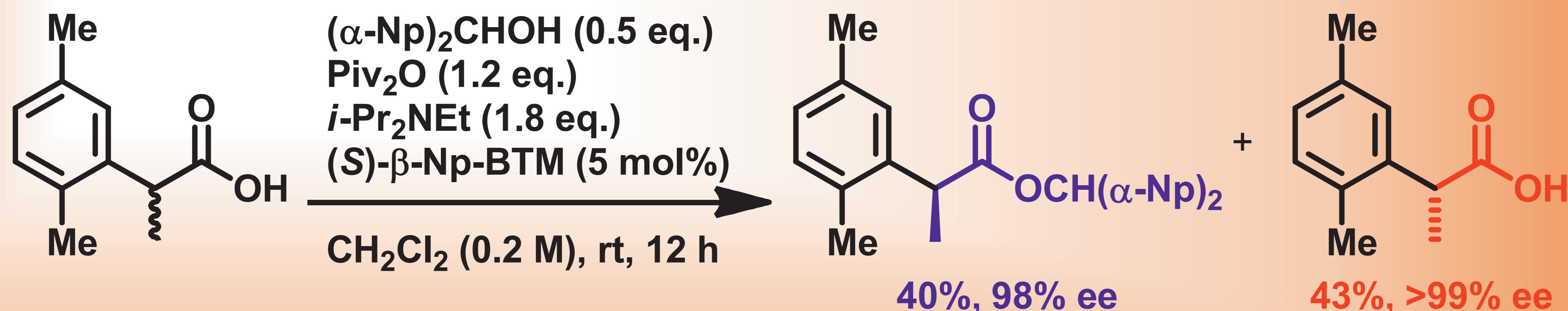
主な研究テーマ

2-ピロイルプロピオン酸の動的速度論的光学分割



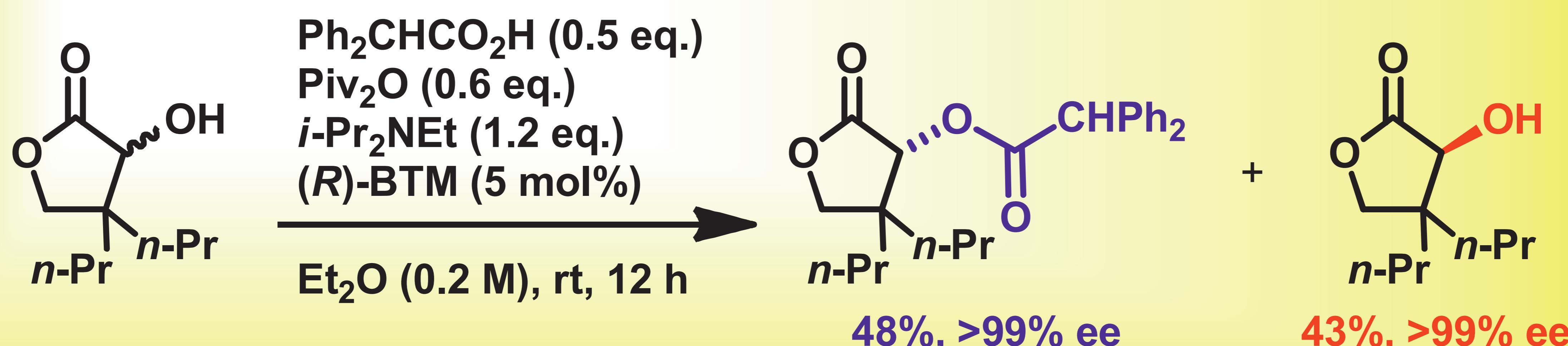
Patent submitted.

2-アリールプロピオン酸の速度論的光学分割



Reference: Shiina, I.; Nakata, K.; Ono, K.; Onda, Y.; Itagaki, M. *J. Am. Chem. Soc.* **2010**, *132*, 11629-11641.
Shiina, I.; Ono, K.; Nakata, K. *Catal. Sci. Technol.* **2012**, *2*, 2200-2205.

2-オキシカルボニル化合物の速度論的光学分割



Reference: Shiina, I.; Nakata, K.; Ono, K.; Sugimoto, M.; Sekiguchi, A. *Chem. Eur. J.* **2010**, *16*, 167-172.
Nakata, K.; Gotoh, K.; Ono, K.; Futami, K.; Shiina, I. *Org. Lett.* **2013**, *15*, 1170-1173.



TUS Tokyo University of Science

University Research Administration Center
<http://www.tus.ac.jp/en/>