

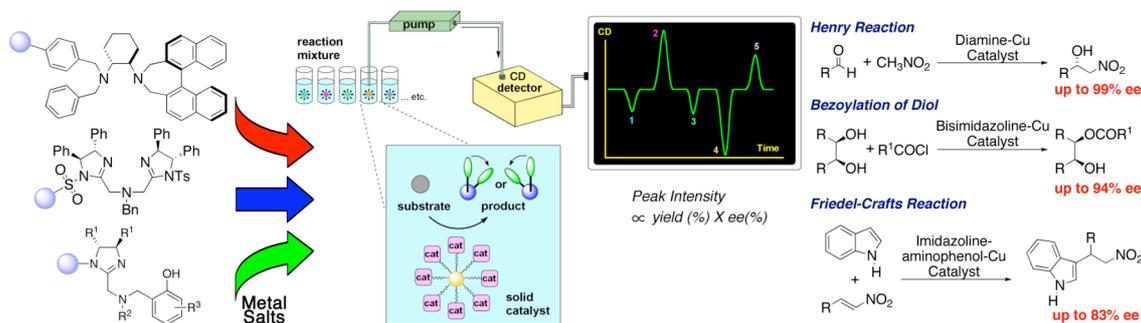
円二色性検出を用いる固相イミダゾリン不斉触媒の開発

(千葉大) ^{あらい}荒井 ^{たかよし}孝義・^{よこやま}横山 ^{なおた}直太・^{みずかみ}水上 ^{ともえ}友絵・^{やなぎさわ}柳澤 ^{あきら}章

医薬品や天然物など、光学活性化合物の合成に有用な触媒的不斉反応の研究には優れた不斉触媒の開発が重要である。しかし、一般的に用いられている液相不斉触媒の開発・評価の手法では煩雑な操作が必要であり、多くの時間と労力を要する。一方、近年注目されているコンビナトリアルケミストリーの手法を取り入れた触媒探索は魅力的であるが、膨大な数の反応に対し、各反応生成物の化学収率・不斉収率を迅速に解析し、評価できる方法が必要となる。我々は、「固相不斉触媒による反応」と「円偏光二色性検出」を組み合わせた迅速解析システムの開発を進め、不斉触媒の探索における研究基盤の刷新を目指し研究を行っている。

下図に示す解析システムでは、不斉触媒を構成する光学活性配位子が固相担体上に局在しているため、アキラルな反応基質を用いて不斉反応を行う場合、反応が進行して生成物に不斉が誘起されない限り、反応液を直接解析しても有意な円二色性スペクトル(CD)は検出されない。また、生成物の単離・精製を行うことなく反応溶液を直接 CD 検出器に導入し、各 CD 吸収ピーク強度を比較することで不斉触媒の有効性を相対的に評価できるため、大幅な解析時間の短縮が実現し、迅速に最良の触媒を探し出すことができる。

今回、同システムを用いて不斉触媒の探索を行ったところ、新規イミダゾリン配位子ならびに優れた触媒的不斉反応を開発する事に成功した。



【参考文献】

- 1) Arai, T.; Watanabe, M.; Fujiwara, A.; Yokoyama, N.; Yanagisawa, A. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2006**, *45*, 5978.
- 2) Arai, T.; Watanabe, M.; Yanagisawa, A. *Org. Lett.* **2007**, *9*, 3595.
- 3) Arai, T.; Mizukami, T.; Yokoyama, N.; Nakazato, D.; Yanagisawa, A. *Synlett* **2005**, 2670.
- 4) Arai, T.; Mizukami, T.; Yanagisawa, A. *Org. Lett.* **2007**, *9*, 1145.