不斉有機触媒
Chiral Organocatalyst

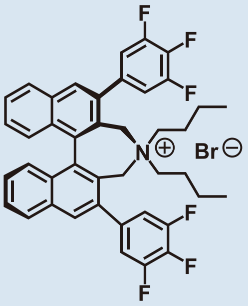
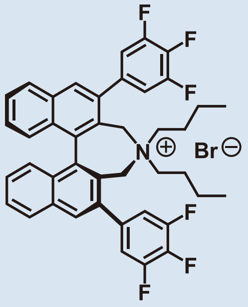
Kanto Reagents

近年、医薬分野を中心に光学活性体の重要性はますます高まっております。不斉合成は光学活性体を、選択的に効率よく合成する方法の一つであり、金属を含まない不斉有機触媒は生成物への金属の混入を回避できるため、光学活性医薬品合成の有効な手段と成り得ることが期待されます。さらに、反応後の廃液に重金属を含まないなど、グリーンケミストリーの観点からも注目されています。
弊社では、高選択性、高触媒活性を示す不斉有機触媒を製品化いたしました。

不斉相間移動触媒（簡素化 丸岡触媒®）

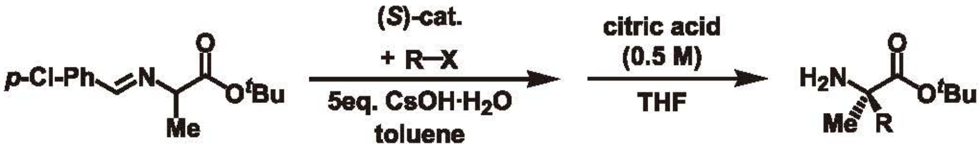
本触媒は **京都大学 丸岡教授** らによって開発され、医薬品中間体等の原料として重要な天然及び非天然型 α - アミノ酸を高効率、高選択的に合成することが可能です。さらに、従来の N- スピロ型不斉相間移動触媒 1)−5) に比べて触媒活性が飛躍的に向上し、使用する触媒量が従来に比べて約 1/100 という特長 5)−6) を有します。

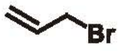
製品紹介

製　品　名	製品番号	容　量	価　格
(*R*)-4,4-Dibutyl-2,6-bis(3,4,5-trifluorophenyl)-4,5-dihydro-3*H*-dinaphtho[2,1-c:1',2'-e]azepinium bromide $C_{42}H_{36}BrF_6N$　FW748.64 外観；白色～褐色固体 光学純度；>98% ee 	11347-68	100 mg	33,000
	11347-95	500 mg	105,000
(*S*)-4,4-Dibutyl-2,6-bis(3,4,5-trifluorophenyl)-4,5-dihydro-3*H*-dinaphtho[2,1-c:1',2'-e]azepinium bromide $C_{42}H_{36}BrF_6N$　FW748.64 外観；白色～褐色固体 光学純度；>98% ee 	11348-68	100 mg	33,000
	11348-95	500 mg	105,000

α,α-ジアルキルアミノ酸の合成

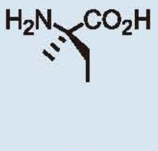
反応例[6)]

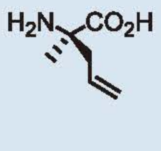


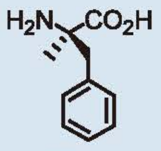
R-X	S / C	Temp. / ℃	Yield / %	ee / % (Config)
	2000	-20	63	98 (*R*)
	2000	0	66	98 (*R*)
	2000	0	60	96 (*R*)

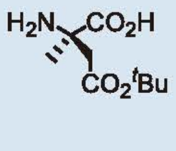
合成例

α,α-ジアルキルアミノ酸

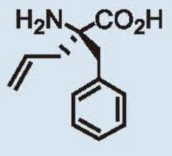

96% ee

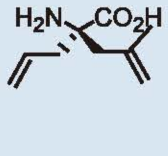

98% ee

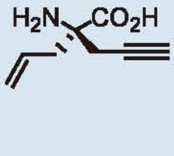

98% ee

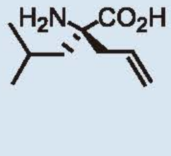

93% ee

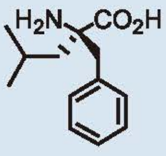
91% ee

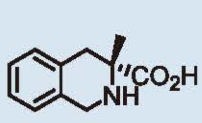

97% ee

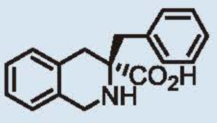

97% ee

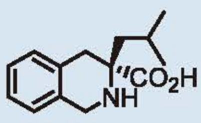

96% ee

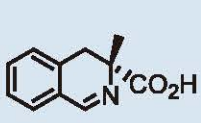

93% ee

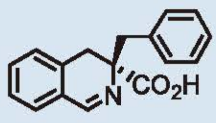

92% ee


88% ee


84% ee


84% ee


94% ee

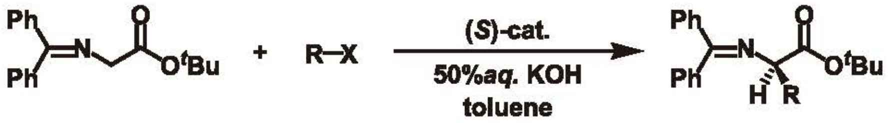

87% ee

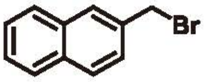
［参考文献］

1) T. Ooi, M. Kameda, K. Maruoka, *J. Am. Chem. Soc.*, 125, 5139 (2003).
2) T. Ooi, Y. Uematsu, K. Maruoka, *J. Org. Chem.*, 68, 4576 (2003).
3) T. Ooi, M. Takeuchi, M. Kameda, K. Maruoka, *J. Am. Chem. Soc.*, 122, 5228 (2000).
4) T. Ooi, M. Takeuchi, K. Maruoka, *Synlett*, 2001, 1185.
5) 丸岡啓二, 有合化, 63, 686 (2005).
6) M. Kitamura, S. Shirakawa, K. Maruoka, *Angew. Chem., Int. Ed.*, 44, 1549 (2005).

α-アルキルアミノ酸の合成

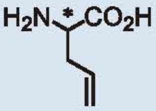
反応例[6)]



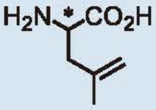
R-X	S / C	Temp. / ℃	Time / h	Yield / %	ee / % (Config)
	2000	0	2	98	99 (*R*)
	2000	0	12	97	99 (*R*)
	10000	0	9	92	98 (*R*)
	2000	0	3	87	98 (*R*)
	2000	0	4	88	98 (*R*)
	1000	-20	1	67	99 (*R*)
	2000	0	64	81	97 (*R*)

合成例

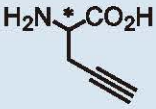
α-アルキルアミノ酸



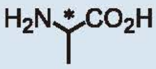
98% ee



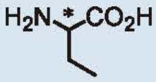
99% ee



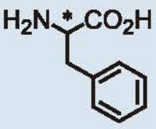
98% ee



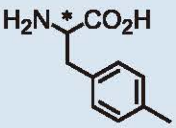
96% ee



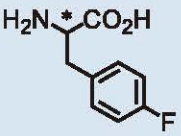
99% ee



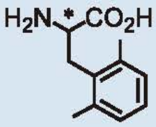
99% ee



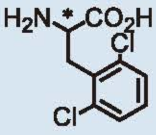
99% ee



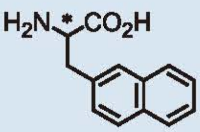
99% ee



99% ee

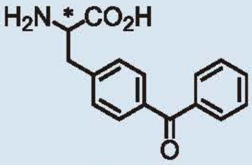


96% ee

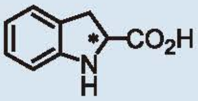


97% ee

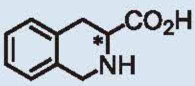
99% ee



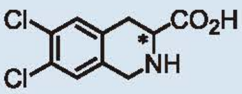
98% ee



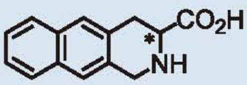
99% ee



98% ee



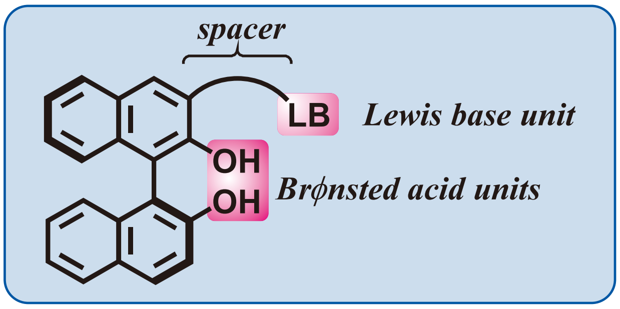
98% ee



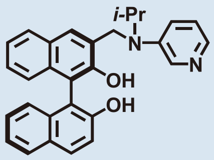
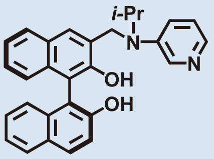
96% ee

多点制御型有機分子触媒

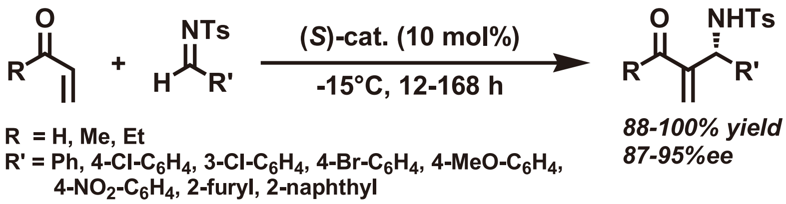
本触媒は **大阪大学 笹井教授** らによって開発され、キラルなBrønsted酸にスペーサーを経てLewis塩基部位が結合しており（右図）、Brønsted酸部位とLewis塩基部位の協同効果によりこれまでに報告されたaza-Morita-Baylis-Hillman（aza-MBH）反応の触媒[7)−10)]に比べて高い選択性、触媒活性を示します。



製品紹介

製　品　名	製品番号	容　量	価　格
(*R*)-3-(*N*-Isopropyl-*N*-3-pyridinylaminomethyl)-1,1'-bi-2-naphthol $C_{29}H_{26}N_2O_2$　FW434.53 外観；薄緑色～白色粉末 純度；>98% 光学純度；>99% ee 	20331-95	200 mg	12,500
(*S*)-3-(*N*-Isopropyl-*N*-3-pyridinylaminomethyl)-1,1'-bi-2-naphthol $C_{29}H_{26}N_2O_2$　FW434.53 外観；薄緑色～白色粉末 純度；>98% 光学純度；>99% ee 	20332-95	200 mg	12,500

反応例[11)]



［参考文献］

7）M. Shi, Y.-M. Xu, *Angew. Chem. Int. Ed.,* 41, 4507（2002）.
8）M. Shi, L.-H. Chen, *Chem. Commun.,* 2003, 1310.
9）D. Balan, H. Adolfsson, *Tetrahedron Lett.,* 44, 2521（2003）.
10）S. Kawahara, A. Nakano, T. Esumi, Y. Iwabuchi, S. Hatakeyama, *Org. Lett.,* 5, 3103（2003）.
11）K. Matsui, S. Takizawa, H. Sasai, *J. Am. Chem. Soc.,* 127, 3680（2005）.

● 本記載の製品は、試薬（試験、研究用として用いる化学薬品）としての用途にご利用ください。 ● 本記載価格に、消費税等は含まれておりません。
● 本記載の製品情報は予告なく変更する場合があります。 最新情報は、弊社ホームページ「Cica-Web」をご確認ください。

関東化学株式会社
試薬事業本部
〒103-0022 東京都中央区日本橋室町２丁目２番１号
TEL : 03-6214-1090
HP : https://www.kanto.co.jp

OEA-05 (202204)