

同 志 社 大 学

2015 年度 個人研究費研究経過・成果報告書

2016年 2月 20日提出

所 属	職 名	氏 名
生命医科学部	教 授	太田 哲男
研 究 題 目	リン触媒を用いるキラルアミノ酸ライブラリ構築法の開発	
研 究 成 果 の 概 要	<p>申請者らはこれまでに、リン化合物とプロピオール酸エステルから生成するホスホニウム塩を鍵中間体とした多成分連結反応によるアミノ酸誘導体の合成反応の開発に成功している (T. Ohta, et al. <i>International JOC</i>, 2012)。この反応は、安価なリン触媒存在下、高い原子効率で多成分を連結したアミノ酸誘導体をワンポットで合成できるため、他の手法に比べて簡便かつ迅速であるという利点をもっている。</p> <p>本年度は、リン触媒を用いる反応によるアミノ酸合成研究に関して、触媒であるリン化合物を取り除き、生成物を効率よく得るための方法論として、固定化触媒の利用を検討した。すなわち、トリフェニルホスフィンをポリスチレンビーズに固定化した PS-PPh₂ が触媒として機能するかどうかを検討した。Bond-elute-reserver を、触媒に PS-PPh₂ を用いて、プロピオール酸エステルと各種基質の反応を検討した。各種反応条件を検討することで、フタルイミドを 1,4-ジオキササン中で反応させることで、86%の収率で目的のデヒドロアミノ酸が得られた。また、DMF を溶媒に使うと、1,2-ジアミノ酸誘導体が 84%の収率で見出された。さらに、フタルイミドとアルデヒドを用いる三成分連結反応でも目的の γ-オキソ-アミノ酸誘導体が 84%の収率で見出された。これらの収率は均一系触媒である PPh₃ を用いる反応とも遜色がなく、単離の容易さを考えると、極めて実用的な反応が開発できたと考えている。</p> <p>さらには、濾過するだけで生成物が分離できる操作の容易さを利用して、触媒の再利用を検討した。すなわち、反応後、液体部分をとかで取り除いたのち、そのまま、次の基質を導入して反応を行えるかどうかの検討を行い、複数回の繰り返し利用が可能であることを見出した。</p>	