

東京理科大 ○村田佳久 神野智之 河井伸之 細川誠二郎 小林進

不斉三級水酸基を含む 1,2-ジオールはマクロライド、ポリエーテルなどの天然物に広く存在しており、Sharpless らはシン-1,2-ジオールのエナンチオ選択的な構築法を開発している。しかし、これらの方法はオレフィンの立体選択的構築とその後の不斉酸化という複数の工程を必要とし、なおかつ不斉三級水酸基を含むアンチ-1,2-ジオールの立体選択的構築には適していない。そこで、我々はアルドール反応により炭素-炭素結合生成と同時に不斉三級水酸基を含む 1,2-ジオールを構築する方法の開発をすることとした。

我々はキラルな乳酸誘導体のアルドール反応におけるルイス酸添加を検討したところ、 $Ti(OiPr)_3Cl$ が高い選択性を示すことを見出した。更に乳酸誘導体の水酸基の保護基が Bn 基と TBS 基では異なる立体化学のアルドール生成体を得られることがわかった。即ち、Bn 基のときはアンチ体、TBS 基のときはシン体が立体選択的に生成した。このことから、原料である乳酸誘導体の保護基と不斉補助基を選ぶことにより不斉三級水酸基を含む 1,2-ジオールのすべての立体化学を作り分けることが可能となった。

