

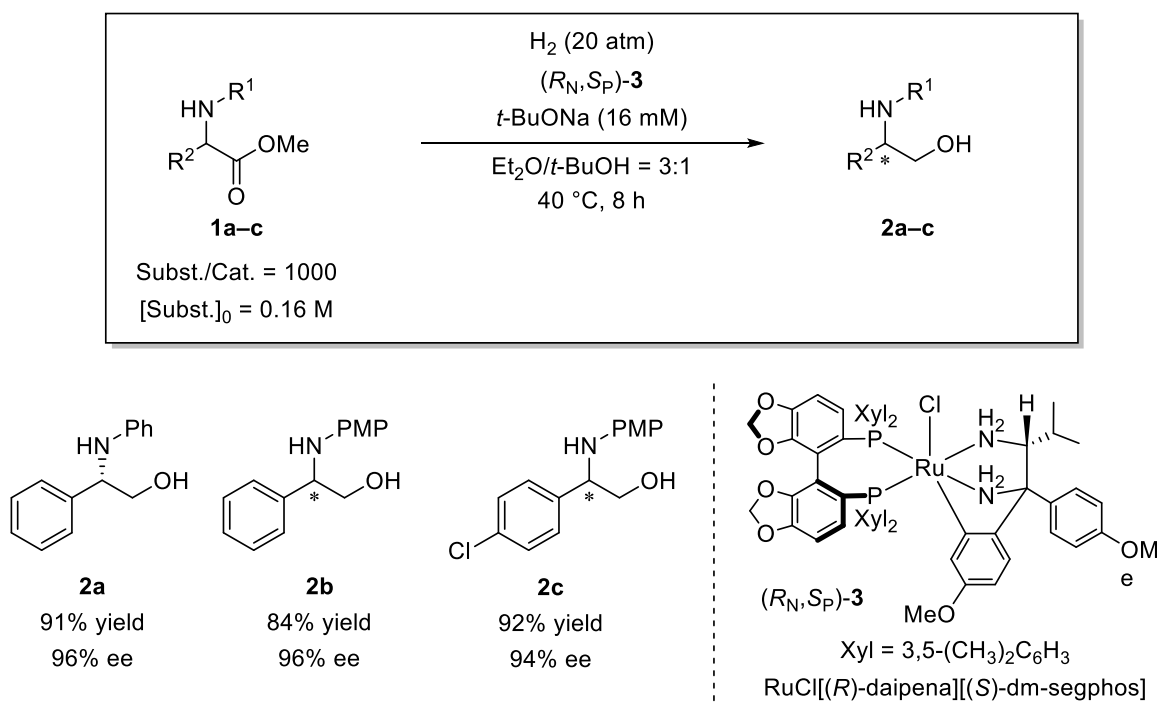


ルテニウム触媒による水素化を用いた  
 $\alpha$ -アミノエステルの動的速度論分割  
**Dynamic Kinetic Resolution of  $\alpha$ -Aminoesters  
 by Ru-Catalyzed Hydrogenation**

上ヶ島 一輝<sup>a</sup>、小松 稜<sup>a</sup>、新井 則義<sup>b</sup>、大熊 毅<sup>b,c</sup>  
 (a 北大院総化、b 北大院工、c フロンティア化学セ)

光学活性  $\beta$ -アミノアルコールは様々な生理活性物質や不斉配位子に含まれる重要な構成要素である。これらの代表的な合成法の例として天然に存在する  $\alpha$ -アミノ酸の還元反応が知られているが、生成物の構造や立体化学が出発物である  $\alpha$ -アミノ酸に依存するため、一般的な光学活性  $\beta$ -アミノアルコールへ適用することは困難であった。還元反応の中でも、触媒的水素化反応は環境負荷が少なく、スケールアップが容易なことから有用なアルコール類の大量供給法として多くの需要がある。今回筆者らは、 $\alpha$ -アミノエステル類の水素化反応に独自に開発した光学活性 Ru(II) 錯体を用いることで、動的速度論分割を伴って、光学活性  $\beta$ -アミノアルコール類が高収率かつ高エナンチオ選択的に得られることを見出した。

一例として、ラセミ体の  $\alpha$ -アミノエステル **1a** を基質に用いた場合、光学活性 Ru(II) 錯体 ( $R_N, S_P$ )-**3** を用いて水素化を行ったところ、*S* 体の  $\beta$ -アミノアルコール **2a** が単離収率 91% かつ鏡像体過剰率 96% で得られた。また、本反応系はアミノ基を脱保護の容易な *p*-メトキシフェニル基 (PMP) で保護した基質にも適用可能であり、対応する光学活性  $\beta$ -アミノアルコールを高収率かつ高エナンチオ選択的に与えた。



## 発表者紹介

氏名 上ヶ島 一輝 (かみがしま かずき)  
 所属 北海道大学大学院総合化学院  
 分子化学コース  
 学年 修士 1 年  
 研究室 有機合成化学研究室 (大熊研究室)

