

# 不斉1、3-双極子付加反応による光学活性2-イソオキサゾリンの効率的合成法の開発

メタデータ	言語: jpn 出版者: 公開日: 2022-07-01 キーワード (Ja): キーワード (En): 作成者: Ukaji, Yutaka メールアドレス: 所属:
URL	<a href="https://doi.org/10.24517/00066588">https://doi.org/10.24517/00066588</a>

This work is licensed under a Creative Commons Attribution-NonCommercial-ShareAlike 3.0 International License.



# 不斉1、3-双極子付加反応による光学活性2-イソオキサゾリンの効率的合成法の開発

Research Project

All

## Project/Area Number

05854050

## Research Category

Grant-in-Aid for Encouragement of Young Scientists (A)

## Allocation Type

Single-year Grants

## Research Field

Organic chemistry

## Research Institution

Kanazawa University

## Principal Investigator

宇梶 裕 金沢大学, 理学部, 助教授 (80193853)

## Project Period (FY)

1993

## Project Status

Completed (Fiscal Year 1993)

## Budget Amount [\\*help](#)

¥900,000 (Direct Cost: ¥900,000)

Fiscal Year 1993: ¥900,000 (Direct Cost: ¥900,000)

## Keywords

光学活性2-イソオキサゾリン / アリルアルコール / 酒石酸エステル / ジエチル亜鉛 / ニトリルオキシド / ヒドロキシモイルクロリド / 1、3-双極子付加反応 / エナンチオ選択的

## Research Abstract

光学活性2-イソオキサゾリンは、還元的条件で容易にbeta-ヒドロキシケトン、gamma-アミノアルコール等の化合物へと変換できる有用な合成中間体であるが、エナンチオ選択的な光学活性2-イソオキサゾリンの合成法は未だ報告されていない。本研究では、アリルアルコールとニトリルオキシドとのエナンチオ選択的1、3双極子付加反応を開発を試みた。その結果、アリルアルコールにジエチル亜鉛、(+)-酒石酸エステル、続いてジエチル亜鉛を加えて亜鉛で架橋したアルコキシ亜鉛中間体を生成させた後、ヒドロキシモイルクロリドを作用させて反応を行ったところ、エチル亜鉛が塩基として働いてニトリルオキシドが系内で発生し、引き続き1、3-双極子付加反応がエナンチオ選択的に進行し、光学活性(R)-2-イソオキサゾリンが得られてくることを見出した。反応溶媒としては、エーテル系溶媒、トルエンに比べてハロゲン系溶媒の方が良く、ハロゲン系溶媒の中でも特にクロロホルムを用いた場合、極めて高い光学純度で対応する2-イソオキサゾリンを得ることができた。不斉源のエステル基の違いによる光学純度の違いはそれほど見られなかったが、イソプロピルエステルを用いた場合、特に収率良いことがわかった。最適条件下、種々のニトリルオキシドについて反応を行ったところ、何れの場合にもほぼ95%ee以上の高い光学純度で、対応する2-イソオキサゾリンを得ることを明らかにできた。本、1、3-双極子付加反応の特徴としては、1)極めて高い光学純度で、2-イソオキサゾリンを得ることができ、2)不斉源の導入、除去が不要であり、3)不斉源の酒石酸ジイソプロピルが、RRである(+)体、SSである(-)体のどちらも入手が容易であることから、2-イソオキサゾリン化合物の両鏡像体が合成できることが挙げられる。

## Report (1 results)

1993 Annual Research Report

## Research Products (5 results)

All Other

All Publications (5 results)

[Publications] Y.Ukaji: "Enantioselective Synthesis of 2-Isoxazolines via Asymmetric 1,3-Dipolar Cycloaddition of Nitrile Oxides to Achiral Allyl Alcohol" Chem.Lett.1847-1850 (1993) ▼

[Publications] Y.Ukaji: "Control of Enantiofacial Differentiation in the Addition Reaction of Organometallics to a Nitron in the Presence of an External Chiral Auxiliary" Chem.Lett.1313-1316 (1993) ▼

[Publications] Y.Ukaji: "Synthesis of Silicon Substituted Cyclopropylmethyl Alcohols in Optically Active Form via Asymmetric Simmons-Smith Reaction of gamma-Silicon Substituted Allylic Alcohols" Chem.Lett.1227-1230 (1993) ▼

[Publications] T.Fujisawa: "A Stereocontrolled Method for the Synthesis of Each of the Four Diastereomers of 3,4-Dialkyl-Substituted beta-Lactams Using Different Metal Ester Enolates and a Chiral Imine" Tetrahedron Lett.34. 1307-1310 (1993) ▼

[Publications] Y.Ukaji: "Regulation of Diastereofacial Selection in the Allylation Reaction of N-Acyliminium Ion Utilizing Lewis Acids" Chem.Lett.221-224 (1993) ▼

URL: <https://kaken.nii.ac.jp/grant/KAKENHI-PROJECT-05854050/>

Published: 1993-03-31 Modified: 2018-06-07