

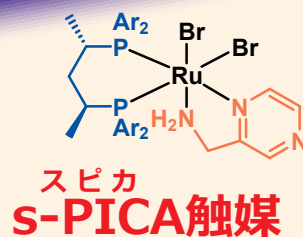
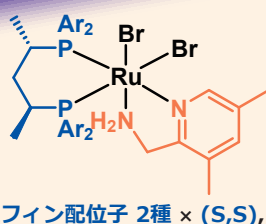
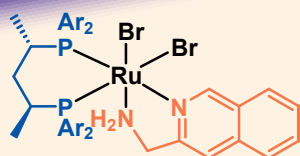
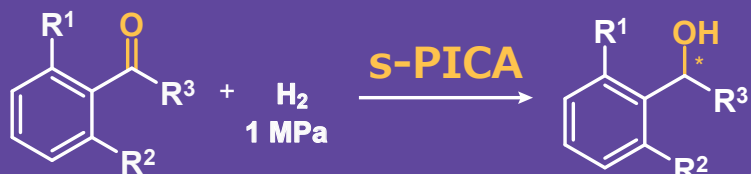
不斉水素化触媒

s-PICA触媒



Kanto Reagents

不斉反応をあきらめていたあのケトンが
高エナンチオ選択的に光学活性アルコールへ！



スピカ
s-PICA触媒

ジホスフィン配位子 2種 × (S,S),(R,R) × ジアミン配位子 3種 = 12種

Ar = 3,5-*i*-Pr₂C₆H₃ [dipskewphos]
Ar = 3,5-Me₂C₆H₃ [xylskewphos]

3-(aminomethyl)isoquinoline [3-AMIQ]
3,5-Dimethyl-2-picolylamine [3,5-DMPICA]
2-Aminomethylpyrazine [AMPZ]

北海道大学 大熊教授らと共同開発いたしました、これまでにないユニークな基質適用範囲をもつ、新しい不斉水素化ルテニウム触媒です。

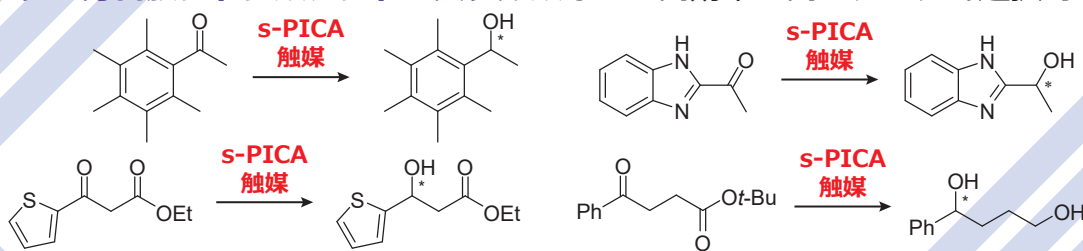
ケトン類を高効率・高エナンチオ選択的に光学活性アルコールに変換します。

反応条件の選択により、ケトエステルをジオールに還元することも可能です。

触媒のバルク供給にも対応しており、工業化プロセスに有用です。

ユニークな基質適用範囲

従来型の触媒では効率的に反応が進まなかった、かさ高い多置換ケトン類や無保護のヘテロ芳香族ケトン類、ケトエステル類などを高効率・高エナンチオ選択的に水素化

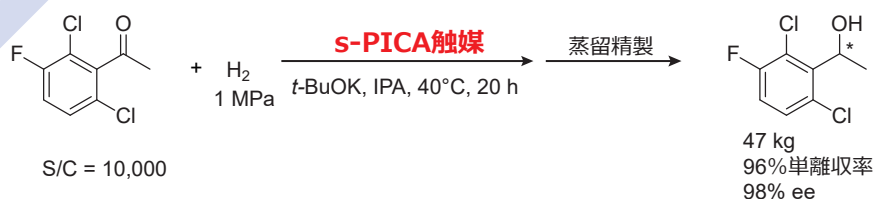


反応例は次ページ

kgスケールでの反応実績

数十kg規模での不斉水素化反応も実績あり。

基質/触媒モル比(S/C)10,000以上の反応も可能。



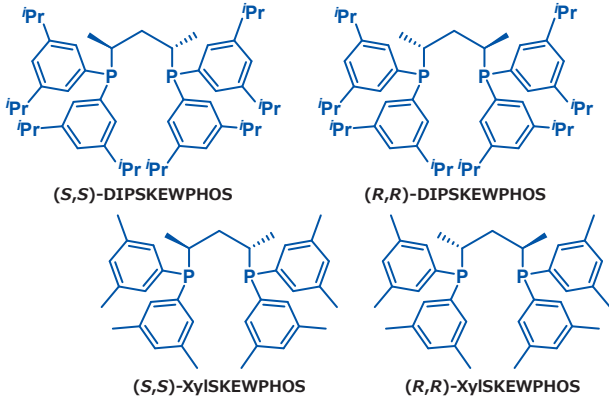
S/C = 10,000

47 kg
96%単離収率
98% ee

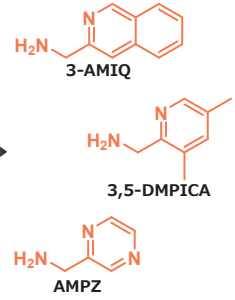
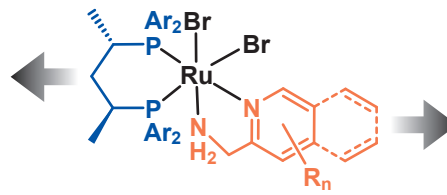


Kanto Kagaku

s-PICA触媒：構成する配位子の一般的な傾向



スピカ S-PICA触媒



ジホスフィン配位子

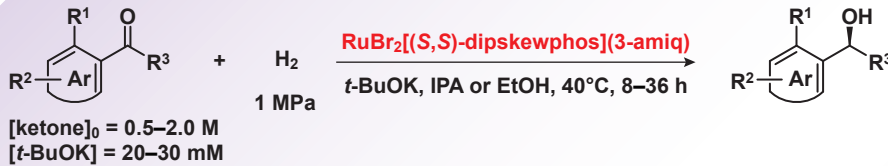
配位子	傾向
DIPSKEWPHOS	エナンチオ選択性に優れる
XylSKEWPHOS	反応性に優れる

ジアミン配位子

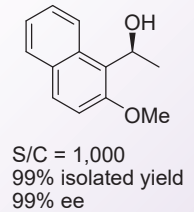
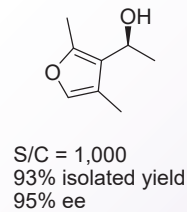
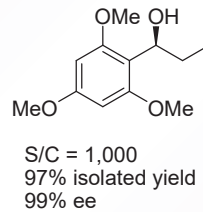
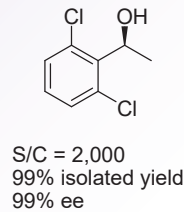
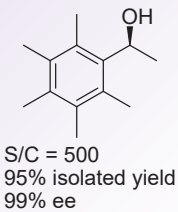
配位子	傾向
3-AMIQ	エナンチオ選択性に優れる
3,5-DMPICA	エナンチオ選択性と価格のバランスが良い
AMPZ	高温域(60-70℃)の反応に適する ヘテロ芳香族ケトン類に適する

不斉水素化反応例

多置換芳香族ケトン類の不斉水素化反応¹⁾、およびその他のケトン類の不斉水素化反応

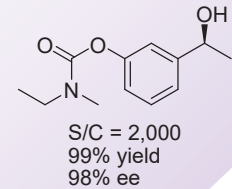
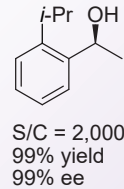
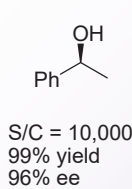
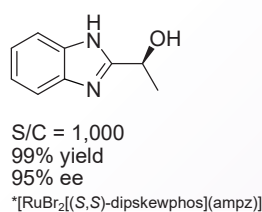
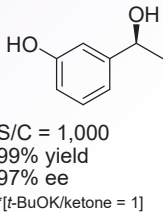


多置換芳香族ケトン類の反応例

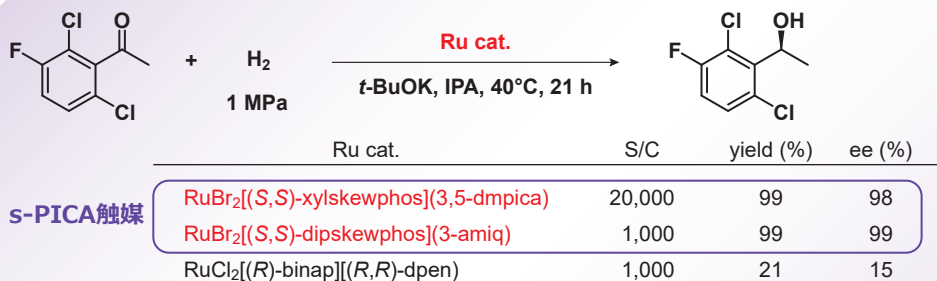


その他のケトン類の反応例

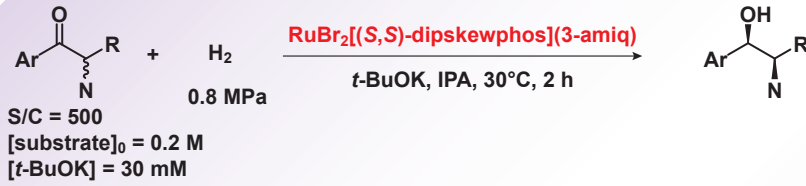
フェノール性水酸基、ベンゾイミダゾール環のNHなど無保護で反応可能!



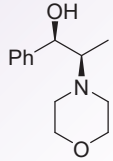
かさ高い多置換ケトンの水素化反応における触媒の比較



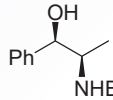
α -アミノケトン類の動的速度論分割を伴う不斉水素化反応



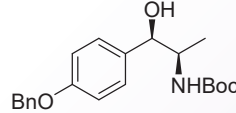
α -アミノケトン類の反応例



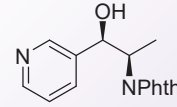
97% isolated yield
syn:anti = 96:4
99% ee



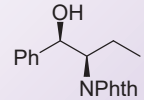
95% isolated yield
syn:anti = 87:13
97% ee



80% isolated yield
syn:anti = 85:15
97% ee



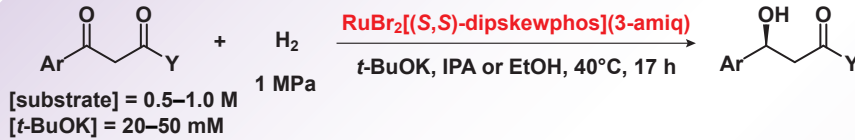
82% isolated yield
syn:anti = 99:1
>99% ee



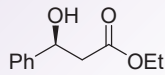
82% isolated yield
syn:anti = 99:1
99% ee

*[$\text{RuBr}_2[(S,S)\text{-dipskewphos}](\text{ampz})$]

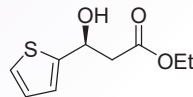
β -ケトエステル、アミドおよび類縁体の不斉水素化反応



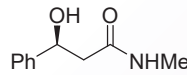
β -ケトエステル、アミドおよび類縁体の反応例



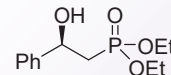
S/C = 5,000
97% yield
99% ee



S/C = 1,000
95% yield
97% ee



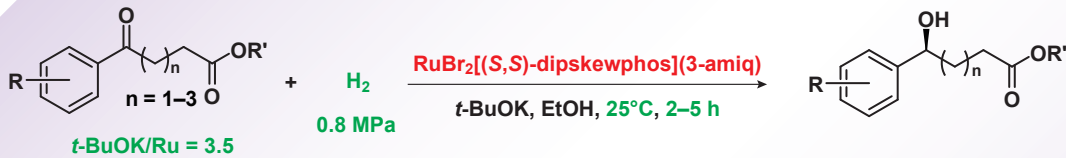
S/C = 500
97% yield
96% ee



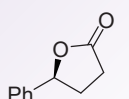
S/C = 500
98% yield
98% ee

*[60°C]
*[$\text{RuBr}_2[(S,S)\text{-dipskewphos}](\text{ampz})$]

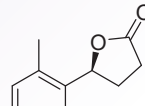
γ -、 δ -および ϵ -ケトエステル類の不斉水素化反応²⁾



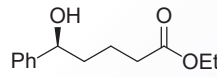
γ -、 δ -および ϵ -ケトエステル類の反応例



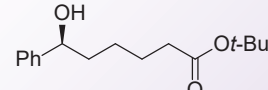
S/C = 5,000
97% isolated yield
97% ee



S/C = 5,000
97% isolated yield
99% ee

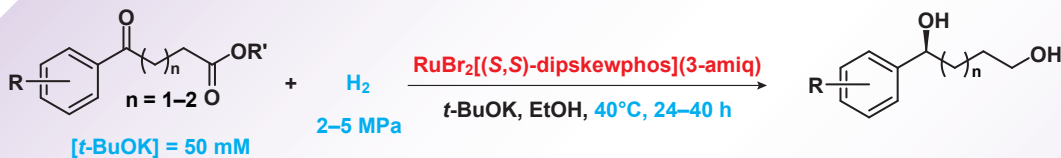


S/C = 500
99% yield
>99% ee

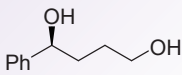


S/C = 500
99% yield
99% ee

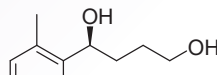
γ -および δ -ケトエステル類のジオールへの不斉水素化反応²⁾



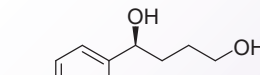
γ -および δ -ケトエステル類のジオールへの反応例



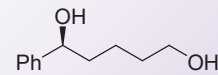
S/C = 5,000
97% isolated yield
96% ee



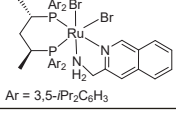
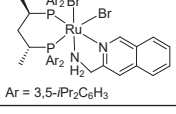
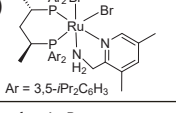
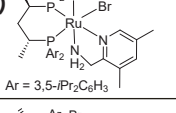
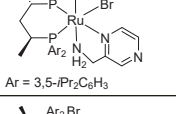
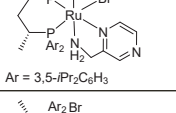
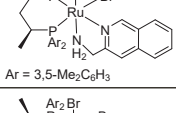
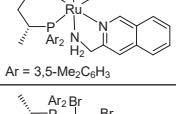
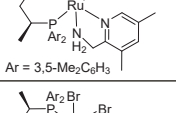
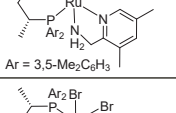
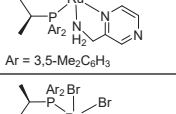
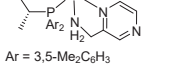
S/C = 5,000
97% isolated yield
98% ee



S/C = 500
96% isolated yield
95% ee



S/C = 500
96% isolated yield
98% ee

製品名	製品番号	包装	価格(¥)	
ジブロモ[(<i>S,S</i>)-DIPSKWPHOS](3-AMIQ)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>S</i> ,4 <i>S</i>)-2,4-bis[bis(3,5-diisopropylphenyl)phosphino]pentane] (3-aminomethylisoquinoline)ruthenium(II) CAS : 2170985-21-2 FW : 1196.24	 Ar = 3,5- <i>i</i> -Pr ₂ C ₆ H ₃	10163-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>R,R</i>)-DIPSKWPHOS](3-AMIQ)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>R</i> ,4 <i>R</i>)-2,4-bis[bis(3,5-diisopropylphenyl)phosphino]pentane] (3-aminomethylisoquinoline)ruthenium(II) CAS : - FW : 1196.24	 Ar = 3,5- <i>i</i> -Pr ₂ C ₆ H ₃	10164-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>S,S</i>)-DIPSKWPHOS](3,5-DMPICA)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>S</i> ,4 <i>S</i>)-2,4-bis[bis(3,5-diisopropylphenyl)phosphino]pentane] (2-aminomethyl-3,5-dimethylpyridine)ruthenium(II) CAS : 2241509-73-7 FW : 1174.23	 Ar = 3,5- <i>i</i> -Pr ₂ C ₆ H ₃	10173-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>R,R</i>)-DIPSKWPHOS](3,5-DMPICA)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>R</i> ,4 <i>R</i>)-2,4-bis[bis(3,5-diisopropylphenyl)phosphino]pentane] (2-aminomethyl-3,5-dimethylpyridine)ruthenium(II) CAS : - FW : 1174.23	 Ar = 3,5- <i>i</i> -Pr ₂ C ₆ H ₃	10181-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>S,S</i>)-DIPSKWPHOS](AMPZ)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>S</i> ,4 <i>S</i>)-2,4-bis[bis(3,5-diisopropylphenyl)phosphino]pentane] (2-aminomethylpyrazine)ruthenium(II) CAS : - FW : 1147.16	 Ar = 3,5- <i>i</i> -Pr ₂ C ₆ H ₃	10165-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>R,R</i>)-DIPSKWPHOS](AMPZ)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>R</i> ,4 <i>R</i>)-2,4-bis[bis(3,5-diisopropylphenyl)phosphino]pentane] (2-aminomethylpyrazine)ruthenium(II) CAS : - FW : 1147.16	 Ar = 3,5- <i>i</i> -Pr ₂ C ₆ H ₃	10166-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>S,S</i>)-XylSKWPHOS](3-AMIQ)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>S</i> ,4 <i>S</i>)-2,4-bis[di(3,5-xyl)phosphino]pentane] (3-aminomethylisoquinoline)ruthenium(II) CAS : 1646350-83-5 FW : 971.80	 Ar = 3,5-Me ₂ C ₆ H ₃	11214-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>R,R</i>)-XylSKWPHOS](3-AMIQ)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>R</i> ,4 <i>R</i>)-2,4-bis[di(3,5-xyl)phosphino]pentane] (3-aminomethylisoquinoline)ruthenium(II) CAS : - FW : 971.80	 Ar = 3,5-Me ₂ C ₆ H ₃	11215-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>S,S</i>)-XylSKWPHOS](3,5-DMPICA)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>S</i> ,4 <i>S</i>)-2,4-bis[di(3,5-xyl)phosphino]pentane] (2-aminomethyl-3,5-dimethylpyridine)ruthenium(II) CAS : 1646350-81-3 FW : 949.80	 Ar = 3,5-Me ₂ C ₆ H ₃	11218-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>R,R</i>)-XylSKWPHOS](3,5-DMPICA)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>R</i> ,4 <i>R</i>)-2,4-bis[di(3,5-xyl)phosphino]pentane] (2-aminomethyl-3,5-dimethylpyridine)ruthenium(II) CAS : - FW : 949.80	 Ar = 3,5-Me ₂ C ₆ H ₃	11219-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>S,S</i>)-XylSKWPHOS](AMPZ)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>S</i> ,4 <i>S</i>)-2,4-bis[di(3,5-xyl)phosphino]pentane] (2-aminomethylpyrazine)ruthenium(II) CAS : 1646350-84-6 FW : 922.73	 Ar = 3,5-Me ₂ C ₆ H ₃	11216-68	100 mg	15,000
ジブロモ[(<i>R,R</i>)-XylSKWPHOS](AMPZ)ルテニウム(II) Dibromo[(2 <i>R</i> ,4 <i>R</i>)-2,4-bis[di(3,5-xyl)phosphino]pentane] (2-aminomethylpyrazine)ruthenium(II) CAS : - FW : 922.73	 Ar = 3,5-Me ₂ C ₆ H ₃	11217-68	100 mg	15,000

その他の不斉水素化触媒や水素移動型不斉還元触媒、これら触媒技術で合成した光学活性アルコール類、DIPSKWPHOS配位子、XylSKWPHOS配位子、SKEWPHOS配位子などの配位子単体の取り扱いもごさいます。詳細はお問い合わせください。

引用文献

- 1) N. Utsumi, N. Arai, K. Kawaguchi, T. Katayama, T. Yasuda, K. Murata, T. Ohkuma, *ChemCatChem* **2018**, *10*, 3955.
- 2) N. Arai, T. Namba, K. Kawaguchi, Y. Matsumoto, T. Ohkuma, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2018**, *57*, 1386.

本リーフレットの内容および価格・仕様は予告なく変更する場合がございます。最新の情報は弊社カタログ検索サイト[Cica-Web]にてご確認ください。



関東化学株式会社
試薬事業本部 試薬部

103-0022 東京都中央区日本橋室町2丁目2番1号 (03) 6214-1090
541-0043 大阪市中央区高麗橋3丁目3番11号 (06) 6231-1672
812-0007 福岡市博多区東比恵2丁目2番3号 (092) 414-9361
<< <https://www.kanto.co.jp> >>