

บทคัดย่อ

รหัสโครงการ MRG4980206

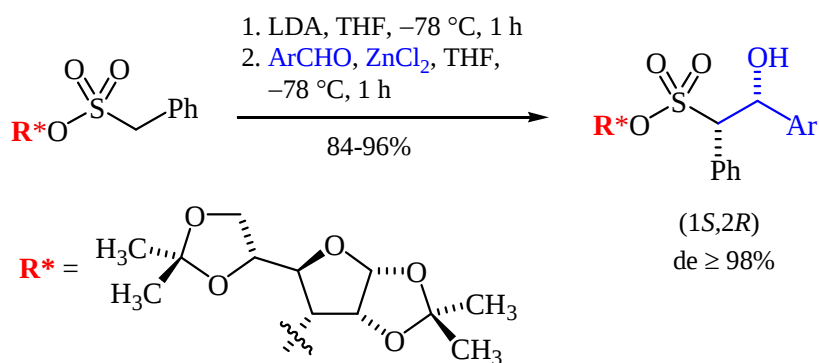
ชื่อโครงการ การสังเคราะห์อนุพันธ์ของกรดซัลโฟนิกแบบอสมมาตรโดยปฏิกิริยาอัลดอลของไครัลซัลโฟเนต

ชื่อนักวิจัยและสถาบัน นางสาววัชรีย์ หาญยิ่ง

ภาควิชาเคมี คณะวิทยาศาสตร์ มหาวิทยาลัยขอนแก่น

ระยะเวลาโครงการ 1 กรกฎาคม 2549 ถึงวันที่ 30 มิถุนายน 2551

จากการศึกษาการสังเคราะห์ β -hydroxy sulfonates แบบอสมมาตรผ่านปฏิกิริยาอัลดอลของไครัลซัลโฟเนตที่มีการควบคุมสเตอริโอเคมีของปฏิกิริยาโดยใช้ 1,2:5,6-di-O-isopropylidene- α -D-allofuranose เป็น chiral auxiliary พบว่าสภาวะของปฏิกิริยาที่ให้ผลสูงสุดทั้งเปอร์เซ็นต์ผลผลิตและการเลือกสรรทางสเตอริโอเคมีคือการทำปฏิกิริยาของ lithiated sulfonates กับอัลดีไฮด์ที่ผสมกับ ZnCl_2 ก่อน โดยพบว่าปฏิกิริยาอัลดอลกับอะโรมาติกอัลดีไฮด์จะให้ผลิตภัณฑ์หลักเป็นไดแอสเทอริโอไอโซเมอร์แบบ *syn* ด้วยเปอร์เซ็นต์ผลผลิตที่อยู่ในเกณฑ์ดีมาก และให้ค่า diastereoselectivities ที่สูง ในการทำปฏิกิริยาการขจัดออกของ chiral auxiliary โดยไม่ทำให้เกิด epimerization นำไปสู่การสังเคราะห์ β -hydroxy sulfonic acids ที่ต้องการด้วยเปอร์เซ็นต์ผลผลิตปานกลางถึงดี และเปอร์เซ็นต์ diastereomeric excess รวมถึง enantiomeric excess ที่สูง ($de, ee \geq 98\%$).



คำหลัก การสังเคราะห์แบบอสมมาตร ซัลโฟเนต ปฏิกิริยาอัลดอล ตัวช่วยเหนี่ยวนำไครอล ไฮดรอกซีซัลโฟเนต

Abstract

Project Code: MRG4980206

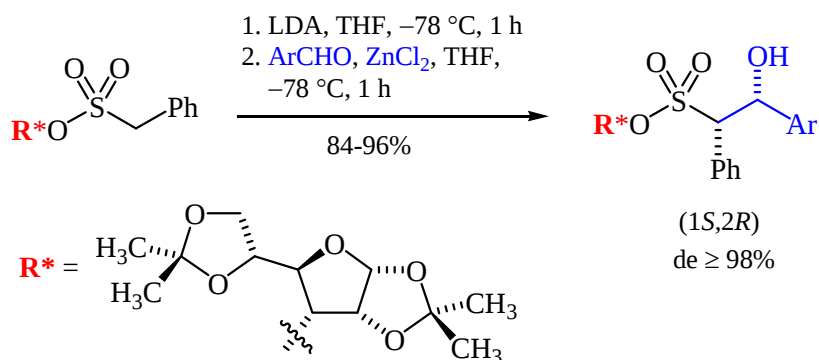
Project Title: Asymmetric Aldol Reactions of Chiral Sulfonates

Investigator: Miss Wacharee Harnying

E-mail Address: hwacha@kku.ac.th; wharnyin@uni-koeln.de

Project Period: 1 July 2006 - 30 June 2008

An efficient asymmetric route to pharmacologically interesting β -hydroxy sulfonic acids has been developed by performing stereocontrolled aldol reactions of sulfonates using 1,2:5,6-di-O-isopropylidene- α -D-allofuranose as a chiral auxiliary. A thoughtful study and optimization of the reaction conditions led to the conclusion that the best conditions regarding both yield and diastereoselectivity involve reacting the lithiated sulfonates with aldehydes being precomplexed with zinc chloride. The reaction with aromatic aldehydes yielded predominantly *syn* adducts in very good yields and excellent diastereoselectivities ($de \geq 98\%$). Successive epimerization-free cleavage of the auxiliary led to the desired β -hydroxy sulfonic acids in moderate to good yields and excellent diastereo- and enantiomeric excesses (de , $ee \geq 98\%$).



Keywords: asymmetric synthesis, sulfonates, aldol reaction, sugar auxiliary, hydroxy sulfonates