Synthesis of (S)-Glycidol

(S)-グリシドールの合成

Keiko NOZAWA, Takatoshi MIYASAKA, Tadayoshi YACHI

Department of Applied Chemistry, Faculty of Engineering, Tokai University

1117, Kitakaname, Hiratsuka-shi Kanagawa, 259-12, Japan

(Accepted for publication 26 November 1992)

緒 言

光学活性を示す化合物は医学的、生物学的に関心の高いものである。ラセミ体から生理活性を有する光学異性体の選択的分離法は近年晶析法など著しい発展の途である。しかし、対象物質に制限があるなど必ずしも理想的な方法とは言えない。化学的に光学活性体を合成するには、その性質が不安定であったり、ラセミ化を起こ

すなどの問題を伴うため、反応段階の簡略化などが好ましい。光学活性体の合成上有用な(S)-グリシドールの合成を、キラルなグリセリン誘導体であるS-グリセロール-1,2-アセトニドから検討した。中間体として安定な(S)-3-メソロキシ-1,2-エポキシプロパンから希アルカリによるβ-炭素の開環による(S)-グリシドールの合成を可能とした。

結 果

安価で入手しやすいD-マンニトールからアセトン化、二量化、還元により(S)-グリセロール-1,2-アセトニドを得る。今回は、これを原料に次の如く合成した。

各工程の収率は (1) → (3) → (4)

67% 45%

→ (5) → (7) であった。

60% 12.5%

また旋光度 $[\alpha]_D^{25}$ は (2) 9.2 (C.6.00 MeOH) (3) -9.3 (C.4.99 MeOH) (4) 16.0 (C.5.00 C HCl) (5) 23.7 (C.5.16 MeOH) (7) -12.4 (C.5.01 CHCl) であった (5)~(6) の開裂は 0.05N ~1.0N-NaOHaq で検討した結果 0.1N が最適条件であった。

'92 SAS Intelligent Symposium