光学活性 *N*-ベンジル-1-フェニル エチルアミン

鈴木 正暢*

酒井 健一

Optically Active N-Benzyl-1-phenylethylamine

Masanobu Suzuki* and Kenichi Sakai

(R)-(+)-BPA

(S)-(-)-BPA

N-ベンジル-1-フェニルエチルアミン(BPA)は、*N*-ベンジル- α -メチルベンジルアミンとも呼ばれ、*R* 体が右旋性、*S* 体が左旋性を示す。

1. 製 法

対応する 1-フェニルエチルアミン(PEA)の *R* 体あるいは *S* 体とベンズアルデヒドとの縮合生成物であるシッフ塩基を Pd 系触媒の存在下、メタノール中で水素添加するか、もしくはそのシッフ塩基を水素化ホウ素ナトリウムなどの水素化剤で還元して、それぞれ対応する(*R*)-BPA、(*S*)-BPA が得られる。これら一連の反応でラセミ化は認められない。

(R)-PEA

(R)-BPA

また DMPU(*N,N'*-Dimethylpropyleneurea)を溶媒として、臭化ベンジルと炭酸ナトリウムを用い、(*R*)-または(*S*)-PEA からわずか 1 段階で対応する(*R*)-BPA または(*S*)-BPA を製造する方法¹⁾も知られている。

なお、アセトフェノンとベンジルアミンより調製したシッフ塩基の光学活性ロジウム-ホスフィン錯体を触媒とした不斉水素添加法による製法²⁾も知られているが、

経済性、光学純度の見地から工業化にはまだ改良の余地があると考えられている。

2. 性 質

(*R*)-BPA、(*S*)-BPA は無色から淡黄色の液体である。

分子式 C₁₅H₁₇N

分子量 211.31

沸 点 171 °C/2 kPa

引火点 158 °C(クリーブランド開放式)

溶解度 アルコールやエーテルなど多くの有機溶媒に易溶。水に対する溶解度は 0.014% (20 °C)。

通常の酸性あるいは塩基性条件下ではラセミ化せず、極めて安定な物質である。また使用後は溶剤抽出して、これを蒸留するだけで容易に精製することができる。

3. 規 格

品質規格(山川薬品工業(株))

純 度 99.0% 以上

光学純度 99.0% ee 以上

出荷形態 180 Kg または 17 Kg ドラム

4. 用 途

(*R*)-BPA、(*S*)-BPA は塩基性光学分割剤として、近年しだいにその用途が広がりつつある。また除去可能なベンジル基を有することより、光学活性アミンの不斉合成、さらには不斉誘起剤として用いられている。以下にこれらの使用例を示す。

4.1 光学分割剤として

医薬中間体として有用なシクロプロパンカルボン酸誘導体 1³⁾、2⁴⁾、シクロブタンジカルボン酸誘導体 3⁵⁾の光学分割に使用された報告があり、非常に良好な分割効率

* 山川薬品工業(株) 営業部 ()

* Yamakawa Chemical Industry Co. Ltd. ()

1

2

3
(+)-isomer

4
(-)-isomer

5

有機合成化学協会誌