

可食性ポリフェノールシナピン酸を活性化剤に用いた光グリコシル化反応

(慶大理工) ○白石 知佳子・高橋 大介・戸嶋 一敦

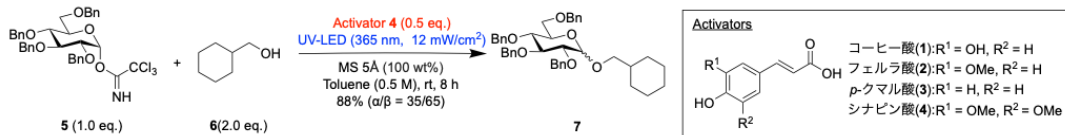
Photo-Induced Glycosylation Using Edible Polyphenol Sinapic acid (*Faculty of Science and Technology, Keio University*) ○Chikako Shiraishi, Daisuke Takahashi, Kazunobu Toshima

Novel environmentally benign and efficient glycosylations are required to establish green carbohydrate chemistry. In this study, we focused on edible polyphenols, caffeic acid (**1**), ferulic acid (**2**), *p*-coumaric acid (**3**), and sinapic acid (**4**), as environmentally benign activators.

Photo-induced glycosylations of glycosyl imidate **5** with cyclohexylmethanol (**6**) using **1-4** were examined. As a result, it was found, for the first time, that when **4** was used, glycosylation reaction proceeded smoothly under long-wavelength UV light irradiation to give corresponding glycoside **7** in high yield. The substrate generality of this reaction will also be reported.

Keywords : Photo-Induced Glycosylation; Edible Polyphenol; Long-wavelength UV Light; Sinapic Acid

医薬品や天然生物活性分子の中には、グリコシド結合を有する配糖体が数多く存在しており、それら配糖体を合成するためのグリコシル化反応が開発されてきた¹⁾。しかし、多くの従来法では、活性化剤として環境高負荷な試薬を必要としており、環境に低負荷かつ効率的に行える新たなグリコシル化反応の開発が強く求められている。このような背景の中、当研究室では、クリーンな光エネルギーで活性化可能な有機光酸触媒を用いた光グリコシル化反応の開発に成功している²⁾。さらに、最近、人体に無害な可食性ポリフェノールであるクルクミン及びエラグ酸を用いた光グリコシル化反応を開発している³⁾。そこで本研究では、新たな活性化剤として、可食性ポリフェノールであるコーヒー酸 (**1**)、フェルラ酸 (**2**)、*p*-クマル酸(**3**)及びシナピン酸 (**4**)を用いた光グリコシル化反応を検討した。その結果、活性化剤としてシナピン酸(**4**)を用いた場合に、グリコシルイミデートドナー**5**とシクロヘキシルメタノール(**6**)との光グリコシル化反応が、365 nm (12 mW/cm², UV-LED)の光照射下で効果的に進行し、望むグリコシド**7**が高収率で得られることを初めて見出した。尚、本反応の基質一般性についても併せて報告する。



- Demchenko, A. V. in *Handbook of Chemical Glycosylation: Advances in Stereoselectivity and Therapeutic Relevance* (Ed.: Demchenko, A. V.), Wiley-VCH, Weinheim, **2008**, pp. 1-27.
- Account: Toshima, K.; Takahashi, D.; Isozaki, Y. *Synlett* **2024**, 35, 777-788.
- (a) Goi, S.; Shigeta, H.; Takahashi, D.; Toshima, K. *Org. Biomol. Chem.* **2024**, 22, 5546-5551. (b) Shigeta, H.; Goi, S.; Takahashi, D.; Toshima, K. submitted.