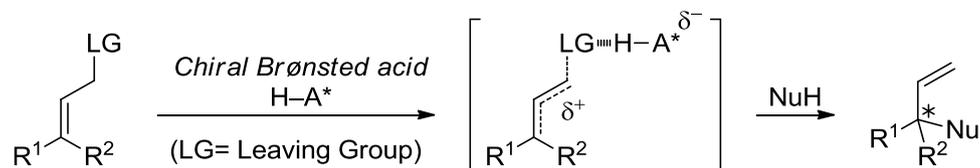


キラルブレンステッド酸触媒を用いた分子内 S_N2' 反応による 第四級不斉中心の構築

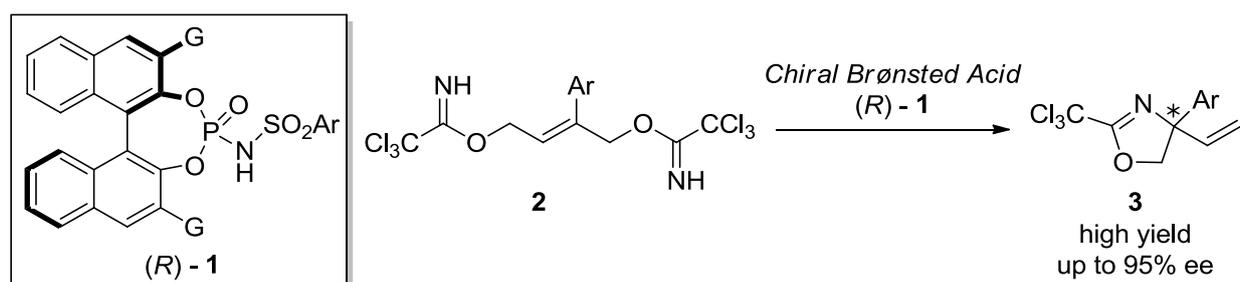
Construction of Quaternary Stereogenic Center via Intramolecular S_N2' Reaction using Chiral Brønsted Acid Catalyst

清水雅大、近藤梓、寺田眞浩（東北大院理）

触媒的不斉合成による第四級不斉中心の構築は有機合成において重要な課題である。有機分子触媒を用いた第四級不斉中心のエナンチオ選択的な構築法として、我々はキラルブレンステッド酸触媒を用いた脱離基の活性化に基づく S_N2' 型反応¹⁾に着目した。この反応では、置換反応の反応点が多置換であるほど遷移状態が安定化されるため、第四級不斉中心の構築法として優れた方法論になると期待される。中でもアリル位に脱離基を有するアルケンを用いた場合、求核剤は S_N2 型で反応して生成物にアルケンが残るため、その後の変換反応に活用でき、魅力的な反応系になると考えられる。そこで今回、我々はキラルブレンステッド酸触媒を用いた脱離基の活性化に基づく S_N2' 型反応によって、第四級不斉中心のエナンチオ選択的な構築を検討したので報告する。



2 位にアリール基の置換した 2-ブテン-1,4-ジオールから容易に誘導される基質を用い、分子内 S_N2' 反応によって第四級不斉中心の構築を試みた。検討の結果、キラルブレンステッド酸触媒 (R)-1 存在下、脱離基、求核部位としてともにトリクロロアセトイミデート基を有する基質 **2** を用いることで、目的とする環化生成物 **3** を高収率かつ高エナンチオ選択的に得ることに成功した。ここで得られる環化生成物 **3** は第四級不斉中心を有するアリール基およびビニル基の置換したアミノアルコール誘導体であり、有機合成上有用なビルディングブロックになると期待される。



<参考文献>

1) Kuroda, Y.; Harada, S.; Oonishi, A.; Yamaoka, Y.; Yamada, K.; Takasu, K. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2015**, *54*, 8263-8266.

発表者紹介

氏名 清水 雅大 (しみず まさひろ)
 所属 東北大学大学院 理学研究科 化学専攻
 学年 博士課程後期 2 年
 研究室 反応有機化学研究室

