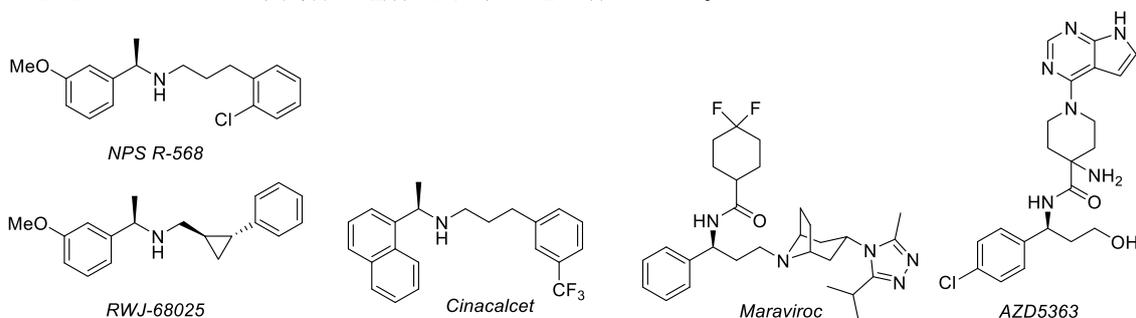


BIPAM-ロジウム触媒を用いる脂肪族イミンの不斉アリール化反応 Rhodium/BIPAM Catalyzed Asymmetric Arylation of Imines

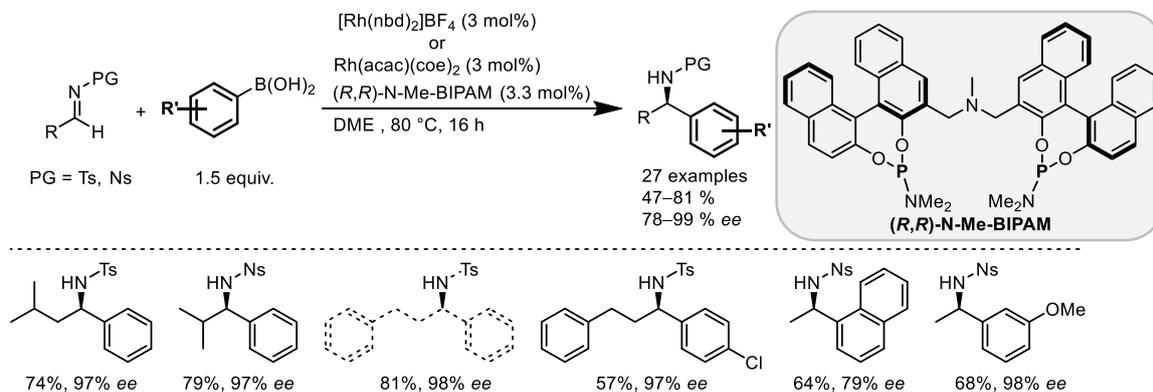
加藤直也¹、山本靖典²
(北大院総化¹・北大院工²)

光学活性な α -分岐アミンは天然物や医薬品に多く見られる重要な部分骨格である。イミンの触媒的不斉ヒドロアリール化反応は、 α -分岐アミンの有用な合成法として認識されており、盛んに研究が行われている (Scheme 1)。

これまでに、我々は、光学活性二座ホスホロアミダイト配位子 (*N*-Me-BIPAM) を開発し、ロジウム/*N*-Me-BIPAM 触媒による芳香族アルジミンおよび α -イミノエステルの不斉アリール化反応に適用し、 α -分岐アミンを高い光学純度で得ることに成功している^{1,2}。本研究では、これまで反応が遅く実用的ではなかった脂肪族イミンの触媒的不斉アリール化反応を試みた。その結果、種々の脂肪族イミンに対して高エナンチオ選択的に反応が進行することを見出した (78–99% ee)³。さらに、本アリール化反応を用いて、カルシウム受容体作動薬として生物活性を示す RWJ-68025, NPS R-568 および Cinacalcet の中間体の合成を行うことに成功した。



Scheme 1



Scheme 2

<参考文献>

- 1) K. Kurihara, Y. Yamamoto, N. Miyaura, *Adv. Synth. Catal.* **2009**, *351*, 260–270.
- 2) Y. Yamamoto, Y. Takahashi, K. Kurihara, N. Miyaura, *Aust. J. Chem.* **2011**, *64*, 1447–1453.
- 3) N. Kato, T. Shirai, Y. Yamamoto, *Chem. Eur. J.* **2016**, *Accepted*.

発表者紹介

氏名 加藤 直也 (かとう なおや)
所属 北海道大学大学院 総合化学院
学年 M1
研究室 有機変換化学研究室

