

新規キラルビスグアニジン触媒を用いたスルホンアミドの不斉ブromo環化反応の開発

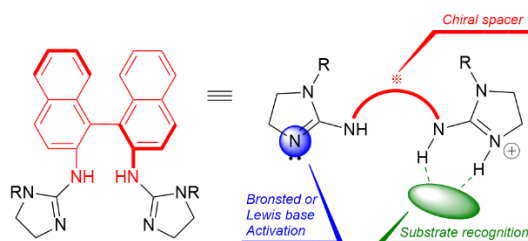
(立教大理) ○本山 健瑠・堤 亮祐・山中 正浩

Development of asymmetric bromocyclization of sulfonamide using a new chiral bisguanidine organocatalyst (College of Science, Rikkyo University) ○Takeru Motoyama, Ryosuke Tsutsumi, Masahiro Yamanaka

We have developed a new chiral bisguanidine organocatalyst bearing two guanidine units linked by a chiral spacer. It was expected that these guanidine units simultaneously capture two substrate in an appropriate position by the cooperative action of multiple hydrogen bonds. In this study, as the utilization of this catalyst, we investigated the highly regio- and enantioselective synthesis of γ -lactam by asymmetric bromocyclization of sulfonamide catalyzed by the chiral bisguanidine.

Keywords : Asymmetric halocyclization; Chiral guanidine catalyst; Organocatalyst

我々は、複数の水素結合が協同的に作用し、基質を適切な位置に捕捉する二重活性化を期待して、2つのグアニジン部位をキラル架橋鎖で連結したキラルビスグアニジン触媒を新規に開発した。本触媒の活用として、本研究では、本触媒を用いたスルホンアミドの不斉ブromo環化反応によるエナンチオ選択的な γ -ラクタム合成について検討を行った。



ビスグアニジン触媒として **cat.1** を用いて、スルホンアミド (**1**) と *N*-ブロモスクシンイミド (NBS) をトルエン中、 -40°C で 24 時間反応させたところ、収率 49%、22% ee で目的の γ -ラクタム (**2**) が得られた。**cat.1** から **cat.7** を用いてイミダゾリン環上の置換基効果を検討したところ、N 上に置換基を持たない場合には副反応が抑制され、収率が向上する傾向がみられた。また不斉炭素上の置換基は本触媒の立体制御機構に大きく影響し、**cat.5** を用いた際に 85% ee と最も高いエナンチオ選択性で **2** が得られることを見出した。現在は **1** の基質一般性を検討している。

