

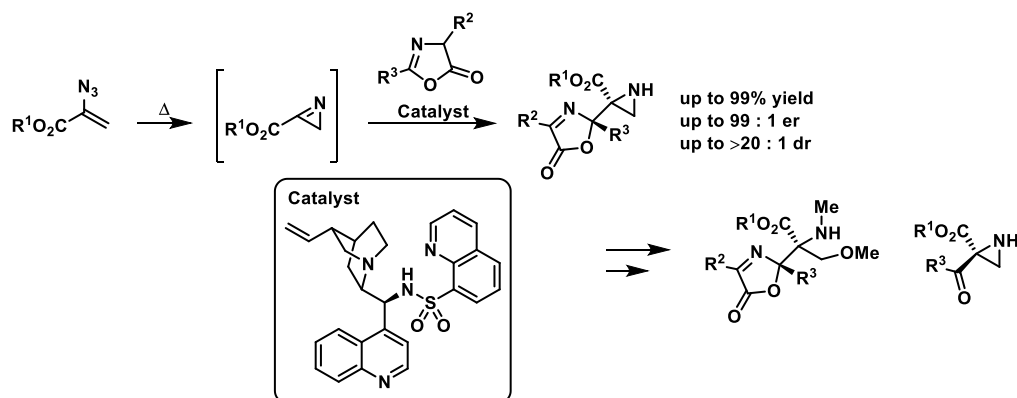
## 2*H*-アジリンへの不斉オキサゾロン付加反応による連続四置換不斉炭素の構築

(名工大院工) ○藤田 和樹・三浦 正剛・中村 修一

Construction of consecutive tetra-substituted stereogenic centers by asymmetric oxazolones addition reaction to 2*H*-azirines (*Graduate School of Engineering, Nagoya Institute of Technology*) ○Kazuki Fujita, Masataka Miura, Shuichi Nakamura

Optically active aziridines are useful structures often observed in biologically active compounds. One of the efficient synthetic methods for chiral aziridines is the asymmetric nucleophilic addition reaction to 2*H*-azirines. However, there are few reports on highly enantioselective nucleophilic addition reaction to 2*H*-azirines using asymmetric catalyst, especially, construction of consecutive tetra-substituted stereogenic centers is rare. Therefore, we examined asymmetric oxazolones addition reaction to 2*H*-azirines by using chiral catalysts. We present here a highly enantioselective synthesis of aziridine having consecutive tetra-substituted stereogenic centers by using cinchona alkaloid catalyst developed in our group. In addition, transformation of obtained aziridines gave  $\beta$ -amino alcohol and aziridyl ketones. **Keywords** : *Enantioselective synthesis; Aziridine; Oxazolone; Cinchona alkaloid; Consecutive tetra-substituted stereogenic centers*

光学活性なアジリジン骨格は生物活性物質中にしばしば見られる有用な構造であり、このような光学活性アジリジンの合成手法の一つとして 2*H*-アジリンへの不斉求核付加反応が挙げられる<sup>1)</sup>。しかし、不斉触媒を用いた高エナンチオ選択的な不斉求核付加反応の報告例は少なく、連続する 4 置換不斉炭素を構築した例はほとんどない。そこで、今回、我々は、2*H*-アジリンに対するオキサゾロンの触媒的不斉求核付加反応の開発を行った。本反応では、当研究室で独自に開発されたシンコナルカロイド触媒を用いることで、連続した 4 置換不斉炭素を有するアジリジンの高エナンチオ選択的合成を達成した。また、合成的変換により、 $\beta$ -アミノアルコールおよびアジリジルケトンの合成にも成功した。



- 1) S. Nakamura, D. Hayama, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2017**, 56, 8785-8789; S. Nakamura, D. Hayama, M. Miura, T. Hatanaka, Y. Funahashi, *Org. Lett.* **2018**, 20, 856-859; H.-J. Zhang, Y.-C. Xie, L. Yin, *Nature Commun.* **2019**, 10, 1699.