

## 新規活性化イミンを用いた光学活性アミン合成法の開発

(名工大院工) ○小山田 悠介・稲葉 主斗・中村 修一

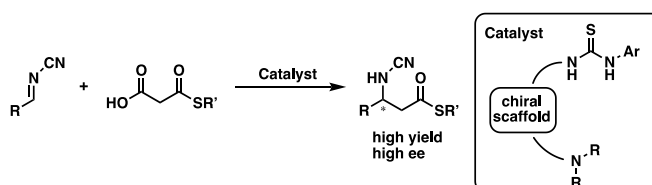
Development of asymmetric synthesis of chiral amines using novel type of activating groups for imines (*Graduate School of Engineering, Nagoya institute of Technology,*) ○Yusuke Oyamada, Kazuto Inaba, Shuichi Nakamura

Chiral amine scaffolds exist in many pharmaceuticals and have been recognized as an important structural motif. In numerous synthetic methodologies of chiral amines, asymmetric nucleophilic addition reaction is widely used as effective synthetic method. Among these asymmetric reactions, activating groups on the nitrogen atom of imines typically play an important role to increase its reactivity and enantioselectivity, and sulfonyl and carbonyl type activating groups have been mainly used. However, there are still limitations of reactivity, enantioselectivity, and atom economy using these activating groups. On the other hand, cyano group is a strong electron-withdrawing group, however, asymmetric reactions of imines activated by cyano group have never been reported. Herein, we developed the first asymmetric synthesis using imines with a cyano group as an activating group. We found that cyano activated imines furnish products with high enantioselectivity using chiral organocatalyst.

**Keywords :** *Optically active amines; Asymmetric organocatalysts; Cyano group*

光学活性アミン構造は、医薬品・生物活性物質中に豊富に存在しており、その効果的合成手法として、イミン類への不斉求核付加反応が広く利用されている<sup>1)</sup>。これらの不斉反応においては、イミン窒素原子上への電子求引性活性化基が反応性の向上および立体制御の鍵となる場合が多く、主としてスルホニル系及びカルボニル系官能基がイミン活性化基として汎用されてきた。しかし、反応性の問題や立体制御に限界がある場合も多く、また、分子量の大きな活性化基の利用は、原子効率の観点からも課題が残されている。一方、シアノ基は強力な電子求引性基であるものの、イミンの活性化基としてイミン窒素原子上に導入し、不斉反応に使用された報告例はこれまでにない。そこで、本研究では、シアノ基を活性化基とするイミンを用いた初の不斉合成手法の開発を行った。

実際に、不斉有機分子触媒を用いた反応系において、シアノ基を活性化基とした場合に、高エナンチオ選択的に反応が進行することが明らかとなった。



- 1) M. Shibasaki, M. Kanai, *Chem. Rev.* **2008**, *108*, 2853-2873; b) S. Kobayashi, Y. Mori, J. S. Fossey, M. M. Salter, *Chem. Rev.* **2011**, *111*, 2626-2704.