

## 有機ホウ素触媒を用いた水素を還元剤とするアミノ酸の還元的アルキル化

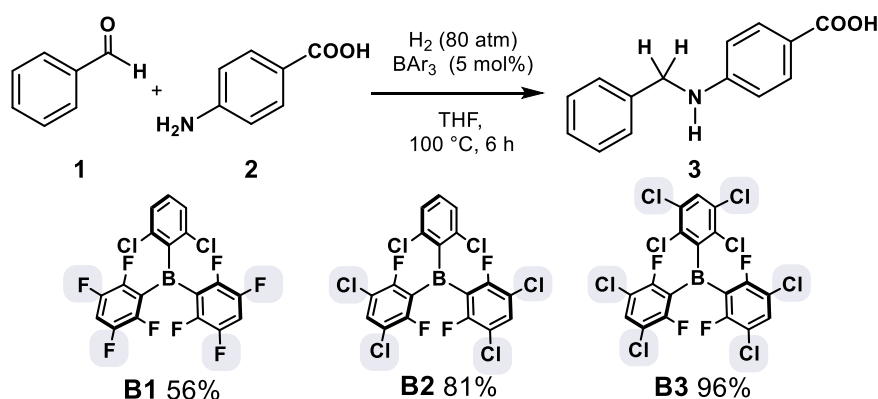
(阪大院工) ○久田 悠靖・橋本 大輝・木下 拓也・星本 陽一・生越 専介  
Organoborane-Catalyzed Reductive Alkylation of Amino Acids with H<sub>2</sub> (*Graduate School of Engineering, Osaka University*) ○Yusei Hisata, Taiki Hashimoto, Takuya Kinoshita, Yoichi Hoshimoto, Sensuke Ogoshi

The reductive alkylation of primary amines using H<sub>2</sub> is the straightforward and important method to derivatize amines, which generates H<sub>2</sub>O as a sole byproduct. Previously, we reported catalytic reductive alkylation reaction that uses triarylboranes (BAr<sub>3</sub>) and H<sub>2</sub> as a catalyst and a reductant, respectively. However, the reported system was not suitable for the transformation of substrates bearing functional groups such as COOH and OH. Herein, we report the further optimization of BAr<sub>3</sub> catalysts for the development of the reductive amination of amino acid derivatives in the presence of H<sub>2</sub>.

**Keywords:** Hydrogenation; Triarylboranes; Frustrated Lewis Pair (FLP); Reductive Alkylation; Amino Acids

水素 (H<sub>2</sub>) を還元剤とする第一級アミンの触媒的還元的アルキル化は、副生成物が水のみである環境低負荷なアミンの合成法である。当研究室はトリアリールホウ素 (BAr<sub>3</sub>) **B1** を触媒<sup>1)</sup>、水素を還元剤とするアミンの還元的アルキル化を報告した<sup>2)</sup>。しかし、**B1** 触媒系をアミノ酸の還元的アルキル化に利用することは難しく、過酷な条件においても収率は中程度に留まった。本研究は、新たな BAr<sub>3</sub> を開発することで、アミノ酸の還元的アルキル化における収率向上を目指した。

触媒量の BAr<sub>3</sub> とアルデヒド **1**、アミン **2** を THF 中にて混合し、H<sub>2</sub> (80 atm) 存在下において 100 °C にて 6 時間攪拌した (Scheme 1)。その結果、第二級アミン **3** が **B1** を用いた場合には 56%、新たに設計した **B2** および **B3** の場合は、それぞれ収率 81%、96%にて得られた。



**Scheme 1.** Reaction between **1** and **2** catalyzed by **B1**, **B2**, and **B3**

1) Á. Gyömöre, M. Bakos, T. Földes, I. Pápai, A. Domján, T. Soós, *ACS Catal.* **2015**, *5*, 5366. 2) Y. Hoshimoto, T. Kinoshita, S. Hazra, M. Ohashi, S. Ogoshi, *J. Am. Chem. Soc.* **2018**, *140*, 7292.