

1,2,4-トリアゾリン-3,5-ジオンを用いた

不斉ヘテロ Diels-Alder 反応の開発

(金沢大院自然科学) ○請井 嵩大・佐藤 優・告野 熙政・菅 拓也・添田 貴宏・宇梶 裕

Development of Asymmetric Hetero Diels-Alder Reaction of 1,2,4-Triazoline-3,5-dione (Graduate School of Natural Science and Technology, Kanazawa University) ○Takahiro Ukei, Yu Sato, Hiromasa Tsugeno, Takuya Suga, Takahiro Soeta, Yutaka Ukaji

Hetero Diels-Alder reaction, also known as [4+2] cycloaddition, is a useful and convenient method for the one-step synthesis of six-membered heterocycles from dienes and dienophiles, and is applicable to synthesis of natural products. 1,2,4-Triazoline-3,5-diones are known as highly reactive nitrogen dienophiles. Hetero Diels-Alder reaction with dienes proceeds rapidly to give the corresponding piperidazine derivatives which are useful synthetic intermediates. In order to develop asymmetric hetero Diels-Alder reaction, 2,4-hexadiene-1-ol was used as a diene under chiral environment derived from metal salts of tartaric acid ester: Chiral induction was scarcely observed. When sorbic acid was used as a diene, the corresponding cycloadduct was obtained in an optically active form.

Keywords : *Asymmetric Hetero Diels-Alder Reaction; 1,2,4-Triazoline-3,5-dione; Tartaric Acid Ester*

ヘテロ Diels-Alder 反応は、ジエンとジエノフィルから複素六員環を一段階で合成できる有用かつ簡便な手法である。1,2,4-トリアゾリン-3,5-ジオンは反応性の高い含窒素ジエノフィルとして知られており、ジエンとのヘテロ Diels-Alder 反応は迅速に進行し、合成中間体として有用なピペリダジン誘導体を与える。当研究室で開発した酒石酸エステル金属塩由来の不斉環境下で、2,4-ヘキサジエン-1-オールをジエンとして用い不斉反応を試みたが、不斉誘起はほとんど発現しなかった。そこでジエンとしてソルビン酸を用い、反応を試みたところ、対応する生成物を光学活性体として得ることができた。

