

## キラルルイス酸触媒を用いた直截的不斉アルドール反応によるβ-ヒドロキシ四級アミノ酸類の立体選択的な合成

(岡山大院自然) 荒木 雄也・花田 将人・溝口 玄樹・○坂倉 彰

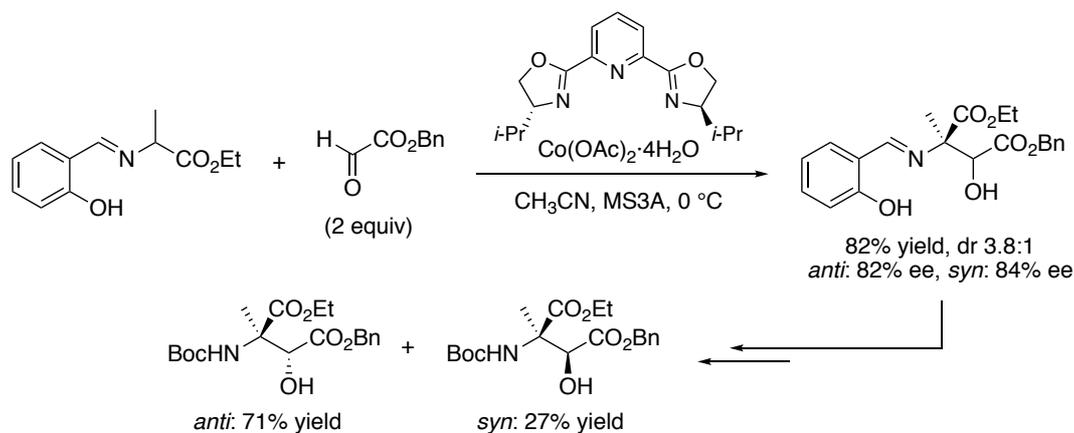
Asymmetric synthesis of β-hydroxy quaternary amino acids via chiral Lewis acid-catalyzed direct aldol reaction (*Graduate School of Natural Science and Technology, Okayama University*) Yuya Araki, Masato Hanada, Haruki Mizoguchi, ○Akira Sakakura

The β-hydroxy-α,α-disubstituted α-amino acid is a valuable structural motif for research in the field of bioorganic chemistry and in the development of peptide drugs. We report here the enantioselective direct-aldol reaction of α-imino esters with glyoxylate esters. We discovered that a catalytic amount of Co(OAc)<sub>2</sub>-pybox complex catalyzed the aldol reaction of salicylaldehyde-derived α-imino esters with benzyl glyoxylate in good yield and enantioselectivity. In addition, hydrolysis of the imine moiety of the aldol products followed by Boc protection of the amino group gave the *N*-Boc-protected amino acid derivatives.

**Keywords :** Direct-aldol reaction; Enantioselective; Amino acid derivative; Lewis acid catalyst; α-imino ester

魅力的な生物活性を有する天然物にはβ-ヒドロキシ四級アミノ酸構造をもつ化合物が数多く存在する。この構造を立体選択的に構築する方法として、当研究室は一昨年の春季年会において、キラルなコバルト(II)錯体を触媒として用いたα-イミノエステルとグリオキシル酸エステルとの直截的不斉アルドール反応を報告した<sup>1</sup>。

今回我々は、課題となっていたジアステレオ選択性の発現とアルドール生成物の誘導、基質適応範囲の調査に取り組んだ。まず反応条件の最適化を行い、反応溶媒やエステル部位の保護基などを検討することにより、良好なエナンチオ選択性を維持したままで中程度のジアステレオ選択性を発現することを見出した。また、アルドール生成物のイミノ基を *N*-Boc アミノ基へと変換することにより、両ジアステレオマーをそれぞれ単離することにも成功した。得られた結果の詳細について報告する。



1) 花田, 荒木, 溝口, 坂倉, 第 100 春季年会, 2B4-49