

硫黄原子上に配置したイミド基を脱離基とするアズラクトンのジスルフィド化反応

(中大理工) ○細野 兼矢・金本 和也・福澤 信一

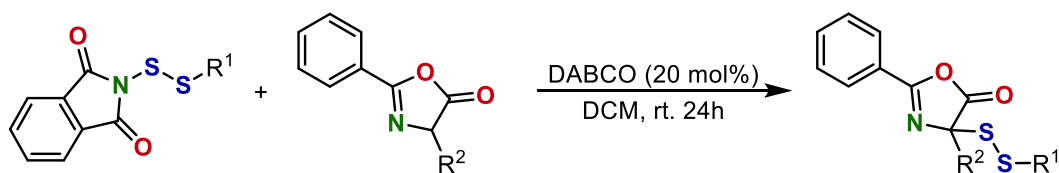
Disulfidation of azlactones using sulfur-bonded imide leaving group (*Department of Applied Chemistry, Faculty of Science and Engineering, Chuo University*) ○Kenya Hosono, Kazuya Kanemoto, Shin-ichi Fukuzawa

Disulfide structures are found in many biologically active natural products and pharmaceuticals, and are expected to be applied in a variety of fields. Recently, a pioneering method for introducing carbon nucleophiles into disulfurating reagents with leaving groups has attracted much attention. In this study, we have developed a novel method to introduce disulfide moieties into azlactones by using disulfidating reagent bearing sulfur-bonded imide leaving group.

Keywords : Disulfide; Azlactone; Amino acid; Imide group; Base catalyst

ジスルフィド構造は、多くの生物活性天然物や医薬品などに含まれており、多彩な分野での応用が期待されている。例えば、機能性分子をつなぎ合わせるリンカーの観点から、生体分子と硫黄を結合させる手法が重要であるが、非対称ジスルフィド合成の困難さ故にゆっくりとしか発展していない。これに対して、ごく最近、脱離基を有するジスルフィド化試薬に対して炭素求核剤を導入する先駆的な手法が報告され、注目を集めている。その一方で、導入できる求核剤はケトエステルや芳香環などに限られており、多彩な求核剤の導入法の開発が求められている。^{1,2}

このような背景のもとで今回我々は、アミノ酸誘導体へのジスルフィド構造の導入に取り組んだ。検討の結果、イミド基を脱離基とするジスルフィド化剤とアズラクトンとの反応が、触媒量の塩基の存在下で効率よく進行することが明らかになった。



1) J. Zou, J. Chen, T. Shi, Y. Hou, F. Cao, Y. Wang, X. Wang, Z. Jia, Q. Zhao, Z. Wang, *ACS Catal.* **2019**, *9*, 11426.

2) W.-C. Gao, J. Tian, Y.-Z. Shang, X. Jiang, *Chem. Sci.* **2020**, *11*, 3903.