

銀触媒を用いるイミノエステルとデヒドロアラニンの 1,3-双極子環化付加反応

(中大理工¹・中大院理工²) ○岩田 真輝¹・町田 陽佳²・金本 和也¹・福澤 信一¹

Silver-catalyzed 1,3-dipolar cycloaddition reaction of iminoesters with dehydroalanines

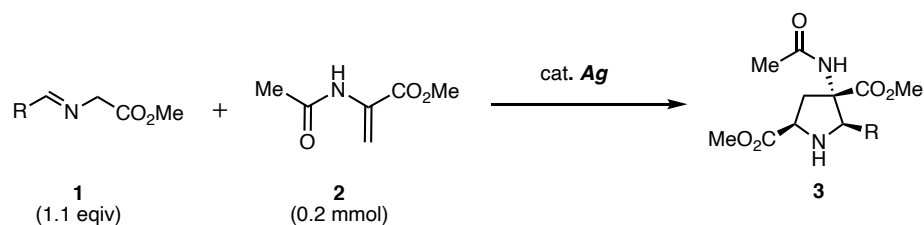
(¹Department of Applied Chemistry, Faculty of Science and Engineering, Chuo University,

²Department of Applied Chemistry, Graduate School of Science and Engineering, Chuo University) ○Masaki Iwata,¹ Haruka Machida,² Kazuya Kanemoto,¹ Shin-ichi Fukuzawa¹

Since dehydroalanine structure is a Michael acceptor derived from amino acids or peptides such as cysteine, its use in peptide modification is attracting attention. In this work, we developed the 1,3-dipolar cycloaddition reaction of imino ester with dehydroalanine. The reaction proceeded efficiently in the presence of silver catalyst with excellent enantioselectivity. *Keywords* : Dehydroalanine; 1,3-Dipolar cycloaddition; Silver catalyst; Azomethine ylide

デヒドロアラニン構造は、アミノ酸やペプチドのシステイン残基などから誘導できるため、Michael アクセプターとしてペプチド修飾などへの利用に注目が集まっている。

これに対して今回我々は、イミノエステルから発生させたアゾメチンイリドとデヒドロアラニン誘導体の 1,3-双極子環化付加反応によって、アミノ酸とアミノ酸を効率的に連結する手法の開発に取り組んだ。検討の結果、銀触媒存在下でイミノエステル **1** と 2-アセトアミドアクリル酸メチル **2** との 1,3-双極子環化付加反応が、高収率かつ高ジアステレオ選択的に反応が進行することが明らかとなった。これまでの手法では、反応性の低さから、窒素原子上をイミド構造とするものが大半であったが、¹⁻³ 本手法はアミド構造でも効率よく反応が進行した。



1) Z. Wang, S. Luo, S. Zhang, W.-L. Yang, Y.-Z. Liu, H. Li, X. Luo, W.-P. Deng, *Chem. Eur. J.* **2013**, *19*, 6739. 2) J. Yang, W. Sun, Z. He, C. Yu, G. Bao, Y. Li, Y. Li, Y. Liu, L. Hong, R. Wang, *Org. Lett.* **2018**, *20*, 7080. 3) G. Bao, P. Wang, G. Li, C. Yu, Y. Li, Y. Liu, Z. He, T. Zhao, J. Rao, J. Xie, L. Hong, W. Sun, R. Wang, *Angew. Chem., Int. Ed.* **2021**, *60*, 5331.