

## 銀錯体触媒系を用いたイミノニトリルの $\alpha, \beta$ -不飽和ケトンへの不斉 Michael 付加反応

(中大院理工<sup>1</sup>・中大理工<sup>2</sup>) ○荒城 春奈<sup>1</sup>・金本 和也<sup>2</sup>・福澤 信一<sup>2</sup>

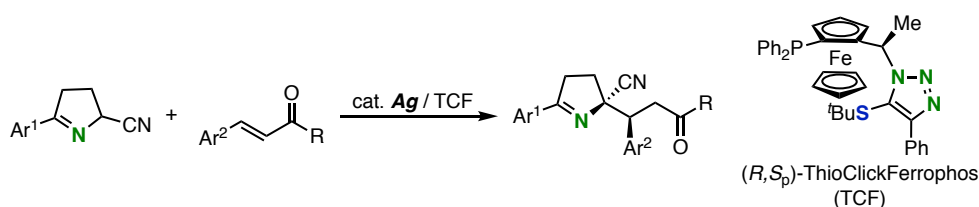
Silver-catalysed asymmetric Michael addition reaction of iminonitrile to  $\alpha, \beta$ -unsaturated ketones (<sup>1</sup>*Department of Applied Chemistry, Graduate School of Science and Engineering, Chuo University*, <sup>2</sup>*Department of Applied Chemistry, Faculty of Science and Engineering, Chuo University*) ○Haruna Araki,<sup>1</sup> Kazuya Kanemoto,<sup>2</sup> Shin-ichi Fukuzawa<sup>2</sup>

Nitrogen-containing 5-membered ring compounds have received significant attention owing to their utility in drug discovery, and reliable methods that enable stereoselective access to the scaffold are desired. In recent years, pyrroline esters have attracted attention as 5-membered ring building block reagents, and several asymmetric Michael addition reactions have been reported. In this work, we developed an asymmetric Michael addition reaction of cyclic iminonitriles with enones. The reaction proceeded in high yield with good diastereo- and enantioselectivity in the presence of Ag/TCF complex. The broad substrate scope of this method, and further transformation, provide convenient access to structurally diversified multisubstituted pyrrolidines in an optically pure fashion.

**Keywords :** Iminonitrile; Azomethine ylide;  $\alpha, \beta$ -Unsaturated ketones; Silver catalyst; Michael addition reaction

含窒素 5 員環化合物は創薬化学などにおける有用性から大きな注目を集めており、5 員環ビルディングブロック試薬に対して立体選択的に置換基を導入する手法の開発が求められている。そのため、近年環状イミノエステルが注目を集めており、不斉 Michael 付加反応などへの利用が報告されている。我々もこれまでに、独自に開発した Ag/ThioClickFerrophos (TCF) 錯体が、環状イミノエステルとエノンとの Michael 付加反応を効率的に触媒し、高いエナンチオ選択性とジアステレオ選択性で付加体を与えることを報告している。<sup>1</sup>

このような有望な結果を基に、今回我々は、立体制御の難しい環状イミノニトリルとエノンとの不斉 Michael 付加反応に取り組んだ。<sup>2</sup> 検討の結果、Ag/TCF 錯体の存在下で効率よく反応が進行し、良好なジアステレオおよびエナンチオ選択性で目的物を与えることが明らかとなった。



- 1) Koizumi, A.; Harada, M.; Haraguchi, R.; Fukuzawa, S.-i. *J. Org. Chem.* **2017**, *82*, 8927.
- 2) Bandar, J. S.; Barthelme, A.; Mazori, A. Y.; Lambert, T. H. *Chem Sci.* **2015**, *6*, 1537.