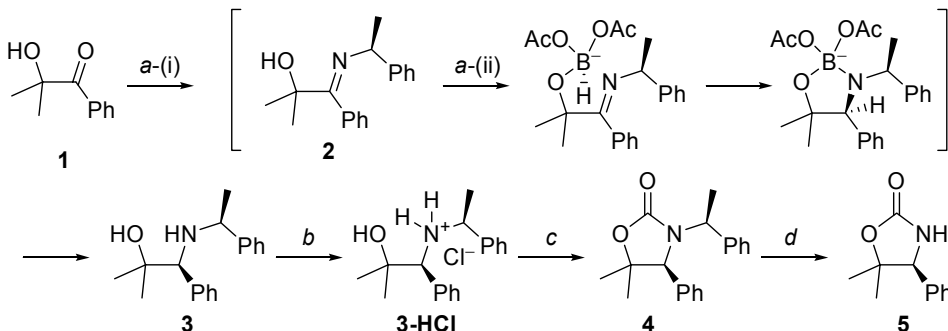


イミンの不斉還元を利用したフェニル型SuperQuatの大量合成法の開発

杉山 重夫¹, 新井 敏史¹, 石井 啓太郎¹(¹明治薬大)

【目的】 Evans 型不斉反応の不斉補助基として開発されたフェニル型 SuperQuat (**5**)の、イミンの不斉還元による大量合成法の開発を目的として検討を行った。

【方法と結果】 ケトン **1** (0.1mol)を(*S*)- α -methylbenzylamine との脱水縮合により(*E*)-イミン **2** とし、*in situ* で NaBH₄-AcOH による水酸基介在型の不斉還元により **3** を得た(82% de)。後処理後 **3** を塩酸塩とし精製 (96% de)、CDI により環化し **4** を得た(96% de)。再結晶により **4** を精製 (>98% de) 後、TfOH-anisole により、 α -メチルベンジル基を除去し、全 4 段階、通算収率 41%で **5** を得た(>99% ee)。



Reagents and conditions: (a) (i) (*S*)- α -methylbenzylamine, TsOH (cata.), toluene, reflux, 24 h; (ii) NaBH₄, AcOH (2 equiv), THF. (b) 4 M HCl in dioxane, hexane (66% from **1**, 82%de). (c) CDI, Et₃N, ClCH₂CH₂Cl, reflux, then recrystallization (74%, >98%de). (d) TfOH, anisole, toluene, 100 °C (84%, >99%ee).