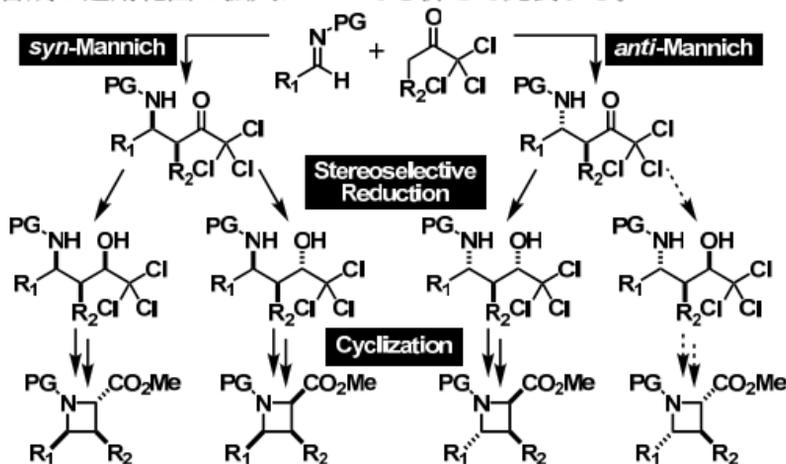


トリクロロメチルケトンを用いた多置換アゼチジンカルボン酸エステルの立体選択的合成

○湯川 猛史<sup>1</sup>, 森本 浩之<sup>1</sup>, 松永 茂樹<sup>1</sup>, 柴崎 正勝<sup>1</sup>(<sup>1</sup>東大院薬)

**【目的】** アゼチジン誘導体は一般に、その四員環の歪みや置換基の立体障害により立体選択的合成は困難である。先の薬学会での発表に加え、今回新たに開発した *anti* 選択的 Mannich 型反応<sup>1</sup>にて得られる Mannich 体の分子内環化反応<sup>2</sup>により、アゼチジンカルボン酸誘導体を立体選択的に合成したので報告する。

**【結果・考察】** *anti*-Mannich 体の立体選択的還元によって生成するアミノアルコールに対し、分子内環化条件(NaOH/DME-H<sub>2</sub>O)を適用したところ、良好な収率かつ高い立体選択性でアゼチジンカルボン酸エステルが得られた。アゼチジンカルボン酸誘導体合成の適用範囲の拡大についても併せて発表する。



1) *Angew. Chem., Int. Ed.* **2008**, *47*, 9125. 2) *Angew. Chem., Int. Ed.* **2006**, *45*, 3146 and references therein.