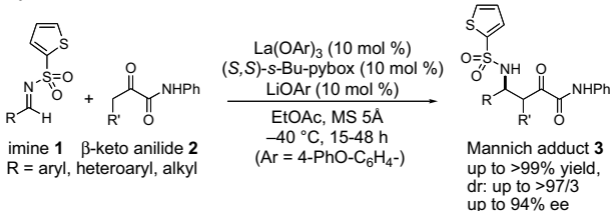


26Q-am008

α -ケトアニリドを求核剤とする *syn*- 選択的直接的触媒的不斉 Mannich 型反応の開発
○ 盧 剛¹, 森本 浩之¹, 松永 茂樹¹, 柴崎 正勝¹ (¹東大院薬)

【目的】我々は $\text{La}(\text{OAr})_3$, pybox, LiOAr ($\text{Ar} = 4\text{-MeO-C}_6\text{H}_4\text{-O}$) から成る複合金属触媒系を開発し、トリクロロメチルケトン求核剤とする直接的触媒的不斉 Mannich 型反応への適用に成功している^{1,2}。本触媒系は、ルイス酸触媒である $\text{La}(\text{OTf})_3/\text{pybox}$ とは全く異なる不斉塩基触媒である。今回、本触媒系のさらなる展開として β -ケトアニリドの直接的触媒的 Mannich 型反応への適用を検討した。

【結果・考察】条件検討の結果、*s*-Bu-pybox、 $\text{La}(\text{OAr})_3$ 及び LiOAr ($\text{Ar} = 4\text{-PhO-C}_6\text{H}_4\text{-O}$) から成る複合金属触媒系を用いた時に、チオフェンスルホニルイミン **1** と β -ケトアニリド **2** の反応が高い化学収率、立体選択性で進行した³。本反応の基質一般性、生成物の変換反応、他の反応への展開についても報告する予定である。



1) *J. Am. Chem. Soc.* **2007**, *129*, 9588. 2) *Angew. Chem., Int. Ed.* **2006**, *45*, 3146. 3) Lu, G.; Morimoto, H.; Matsunaga, S.; Shibasaki, M. *Angew. Chem., Int. Ed.* **2008**, *47*, 6847.