

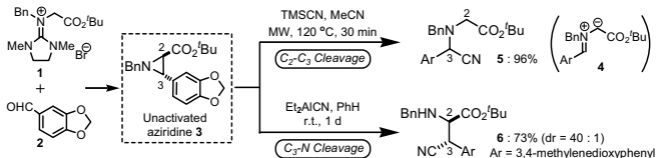
28P-am161

3- アリールアジリジン-2-カルボキシレートとのニトリル求核剤による位置及び立体選択的環開裂反応

○林 由希子¹, 熊本 卓哉¹, 石川 勉¹(¹千葉大院薬)

【目的】我々は、guanidinium 塩 **1** と芳香族 aldehyde **2** からの不活性型 (窒素上に電子供与基を持つ) aziridine **3** の形成反応¹⁾を開発し、この **3** の有機合成への応用を目的とした、酢酸や水などのヘテロ求核試薬や indole などの芳香族化合物を用いる環開裂反応を報告している。²⁾ 特に今回は、芳香族化合物以外の炭素求核試薬として nitrile 基を導入する開環反応について検討した。

【結果および考察】TMSCN による aziridine **3** の開環反応について検討したところ、穏和な条件では反応が進行しないものの、microwave (MW) 照射下での高温条件においては、C₂-C₃ 結合の開裂により生成した azomethine ylide **4** に nitrile が付加した **5** が定量的に生成した。また、十分な Lewis 酸性と求核性を兼ね揃えた永田試薬 (Et₂AlCN) を用いた場合、C₃-N 結合が位置選択的に開裂して **6** が生成した。本反応は高い diastereo 選択性を示したことから、不活性型 aziridine への炭素-炭素結合導入反応として今後十分な利用価値が示唆される。



1) Hada, K. *et al.* *J. Am. Chem. Soc.* **2001**, *123*, 7705.

2) Manaka, T. *et al.* *Helv. Chim. Acta* **2007**, *90*, 128.