

27P-am162

プロリン触媒を用いた 2,3-ジアミノブタン酸の立体選択的合成

○牧野 一石¹, 久保田 さやか¹, 原 聡亮¹, 濱田 康正¹(¹千葉大院薬)

【目的】2,3-ジアミノブタン酸は、現在我々が全合成研究を展開しているパプアミド類の構成アミノ酸のひとつである。今回、有機触媒を用いたその立体選択的合成を検討した。

【方法】(*R*)-アラニンより誘導可能なキラルなβ-アミノアルデヒド(**1**)に対して List らの不斉ヒドラジン化反応を適用し、連続する2つ不斉中心を構築する。その後、N-N結合の切断を経て、ジアミノブタン酸を合成することとした。

【結果および考察】反応基質(**1**)のアミノ基の保護基としては Cbz 基、反応剤であるアゾ化合物(**2**)の保護基には Boc 基を用い、有機触媒として(*R*)-プロリンを作用させることで、syn : anti = 90 : 10 の立体選択性でヒドラジノ化合物を定量的に得た。一方、(*S*)-プロリンを触媒として用いた場合には、syn : anti = 3 : 97 でアンチ体を高い選択性で得ることに成功した。このように誘起される2位の立体化学は、触媒の立体化学の制御下に反応が進行し、プロリン触媒を使いわける

ことでシン体またはアンチ体をそれぞれ優先して得ることが可能である。N-N結合の切断は SmI₂を用いた還元的条件下で行うことが可能であり、ジアミノブタン酸への変換が可能であることを確認している。

