

# 30TF-am07

チオアミドの触媒的不斉ダイレクトアルドール反応

○岩田 光貴<sup>1,2</sup>, 矢崎 亮<sup>1</sup>, 鈴木 優太<sup>1</sup>, 熊谷 直哉<sup>1</sup>, 柴崎 正勝<sup>1</sup>(<sup>1</sup>東大院薬,  
<sup>2</sup>大日本住友製薬)

【目的】チオアミドを求核剤とした触媒的不斉ダイレクトアルドール反応は報告例が無く、アルデヒド共存下でより酸性度の低い $\alpha$ 位水素を有するチオアミドのみを選択的に脱プロトン化するため、困難な反応と考えられてきた。我々はチオアミドのソフトなルイス塩基性に着目し、ソフトルイス酸/ハードBrønsted塩基複合触媒系を用いて、チオアミドの触媒的不斉ダイレクトアルドール反応の開発に着手した。

【結果】検討の結果、 $[\text{Cu}(\text{MeCN})_4]\text{PF}_6/(\text{R},\text{R})\text{-Ph-BPE}/\text{LiOAr}$  触媒系により、反応は官能基選択的に進行し、良好な収率、エナンチオ選択性にて望みのアルドール体 **3** が得られた。**3** のチオアミド部位は容易にアルデヒド **4** へと変換可能で、続く不斉アルドール反応が触媒制御の立体選択性にて進行し、*syn*-, *anti*-1,3-ジオール **5,6** を高立体選択的に与えた。

