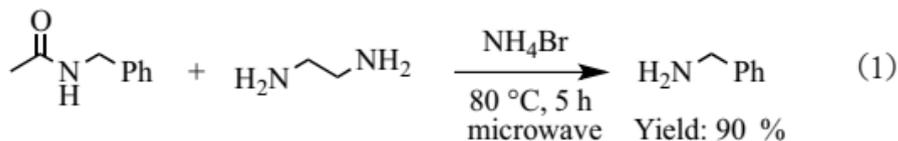


# 29E02-am06S

N-アシル基の脱保護を指向したアンモニウム塩を用いるアミド交換反応の開発  
○清水 悠平<sup>1</sup>, 森本 浩之<sup>1</sup>, 大嶋 孝志<sup>1</sup>(<sup>1</sup>九大院薬)

【目的】アシル基はアミノ基の保護に用いられ、 $\alpha$ -アミノ酸の不斉水素化ではアシル保護したアミノ酸が基質となることから重要な役割を担ってきた。さらに近年では、アミンの C-H 結合活性化や速度論的光学分割を行うに当たり、アシル保護された基質が利用されるなど、その重要性はより高まっている<sup>1,2)</sup>。しかし、*N*-アシル化合物は高い安定性を有するため、アシル基を脱保護するには激しい反応条件が必要であり、用いることの出来る基質に大きな制限があった。本研究ではアミンを求核剤とするアミド交換反応を用いることによって、弱酸性物質であるアンモニウム塩を用いた穏和な条件下での脱アシル化反応の達成を目的とする。

【方法・結果】本研究では、マイクロ波照射条件下において、アンモニウム塩として臭化アンモニウムを、アミンとしてエチレンジアミンを用いることで脱アシル化反応が効率的に進行することを発見した(式 1)。本反応条件では、ホルミル基やアシル基だけでなく、より反応性の低いベンゾイル基を有する基質に関しても適用出来ることを確認している。酸性度の低いアンモニウム塩を用いる本反応は、従来の反応と比べ様々な基質に適用出来る可能性が高く、このような穏和な反応系での脱アシル化反応は初めての例である。



- 1) Chen, G. et al. *Org. Lett.* **2011**, *13*, 4850.
- 2) Bode, J. W. et al. *J. Am. Chem. Soc.* ASAP.