

## イリジウム触媒による飽和環状アミンの $\alpha$ 位不斉アルキル化反応の開発

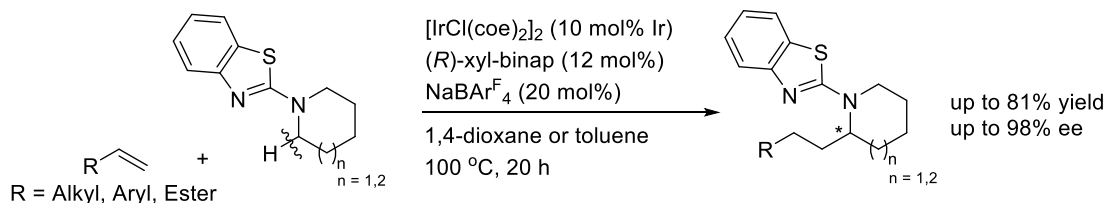
(阪公大院理) ○小林 龍太郎・山川 健太郎・西村 貴洋

Iridium-Catalyzed Enantioselective  $\alpha$ -C–H Alkylation of Saturated Cyclic Amines  
(*Graduate School of Science, Osaka Metropolitan University*) ○Ryutaro Kobayashi, Kentaro Yamakawa, Takahiro Nishimura

Functionalized saturated cyclic amines are key structural motifs in natural products and bioactive compounds, and their enantioselective synthesis has been much studied. Transition-metal-catalyzed enantioselective direct C–H functionalization has been recognized as an efficient way to access chiral cyclic amines in step and atom-economical manners. We have recently developed the iridium-catalyzed enantioselective  $\alpha$ -C–H alkylation of saturated five-membered cyclic amines, where *N*-methylbenzimidazolyl group was used as a directing group for the highly enantioselective alkylation. However, there remained the problem that changing the ring size of saturated cyclic amines reduced the yield and enantioselectivity. Here we report iridium-catalyzed enantioselective alkylation of several saturated cyclic amines including piperidines and azepan having a benzothiazolyl group as an effective directing group for the high enantioselective alkylation reaction.

**Keywords :** Iridium; C–H Activation; Asymmetric Reaction; Saturated Cyclic Amines; Alkylation

官能基化された飽和環状アミンは、天然物や生物活性物質の基本骨格に多く含まれる有用な骨格であり、そのエナンチオ選択的な合成は多く研究されてきた。最近では、遷移金属触媒を用いて飽和環状アミンの C–H 結合をエナンチオ選択的に直接官能基化する反応が開発されている。所属研究室では最近、飽和五員環アミン  $\alpha$  位のエナンチオ選択的な直接 C–H アルキル化反応を初めて開発した<sup>1)</sup>。この反応では、配向基として *N*-メチルベンズイミダゾリル基を用いることで高エナンチオ選択的に付加反応が進行した。しかし、飽和環状アミンの環の大きさを変えると、収率とエナンチオ選択性が大きく低下するという課題が残されていた。本研究では、ベンゾチアゾリル基を配向基に選択することで、6 および 7 員環飽和環状アミンのアルキル化体が高エナンチオ選択的に得られることを見出した。



1) D. Yamauchi, K. Yamakawa, T. Nishimura, *Org. Lett.* **2022**, *24*, 6828.