

# キラル銅錯体触媒を用いるイミノエステルと $\alpha$ -シアノケイ皮酸メチルとのジアステレオおよびエナンチオ選択的 1,3-双極子環化付加反応

(中大理工<sup>1</sup>・中大院理工<sup>2</sup>) ○石田 結衣<sup>1</sup>・佐久間 夕季<sup>2</sup>・福澤 信一<sup>1</sup>

Copper-Catalyzed Diastereo- and Enantioselective 1,3-Dipolar Cycloaddition of Iminoesters with Methyl  $\alpha$ -cyanocinnamate (<sup>1</sup>*Faculty of Science and Engineering, Chuo University*, <sup>2</sup>*Graduate School of Science and Engineering, Chuo University*) ○Yui Ishida<sup>1</sup>, Yuki Sakuma<sup>2</sup>, Shin-ichi Fukuzawa<sup>1</sup>

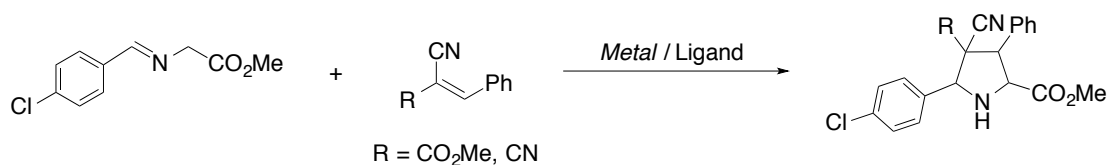
Pyrrolidine compounds with tetrasubstituted carbons at the C4-position show high biological activity, and their stereoselective synthesis is required. One method for the efficient and selective synthesis of these derivatives is the 1,3-dipolar cycloaddition using metal complex catalysts. However, diastereo- and enantioselective synthesis of these reactions with Methyl  $\alpha$ -cyanocinnamate has not yet been achieved.

In this work, we report the diastereoselective 1,3-dipolar cycloaddition of azomethine ylides with cyanoalkene using chiral copper/Fsulphos complexes. The reaction proceeded in good yield, highly diastereoselective synthesis of pyrrolidines with a quaternary carbon at the C4-position.

**Keywords :** Cycloaddition; Azomethine Ylide; Pyrrolidine; Copper Catalyst; Asymmetric Synthesis

C4 位に四置換炭素を有するピロリジン誘導体は、高い生物活性を示し、その立体選択的の合成が求められている。これらを構築する手法として、金属錯体触媒を用いる 1,3-双極子環化付加反応が挙げられる。しかし、これらの反応に  $\alpha$ -シアノケイ皮酸メチルを用いた場合の、ジアステレオ選択的、エナンチオ選択的の合成は未達成である。

今回、我々はキラル銅錯体触媒を用いたアゾメチンイリドとシアノアルケンとの 1,3-双極子環化付加反応によって所望のピロリジン誘導体を高ジアステレオ選択的に得られることを見出した。



1) L.-W. Tang, *et al.*, *Tetrahedron* **2017**, 73, 923-930.

2) V. Rajkumar, *et al.*, *Tetrahedron* **2016**, 72, 5578-5594.