

Synthesis of α -Methylated Amino Acids for Buchwald-Hartwig Cross-Coupling

Synthèse d'acides aminés α -méthylés pour le couplage croisé de Buchwald-Hartwig

Si Trung Dung Phan^{1*}, Kyle D. Passley¹, Michael G. Organ¹

¹University of Ottawa, Ottawa, ON, Canada

*Corresponding author. Email: sphan082@uottawa.ca

Abstract | Résumé

α -Methylated amino acids are valuable components in peptide drugs due to their ability to protect peptides from enzymatic degradation. The objective of this work was to demonstrate that an α methylated amino acid, bearing an alkyl amine side chain, could undergo cross-coupling with an aryl halide via Buchwald-Hartwig amination. Progress has been made toward the synthesis of these amino acids from N-benzyloxycarbonyl-D-alanine.

Les acides aminés α -méthylés sont des composantes précieuses pour les médicaments peptidiques dû à leur habileté à protéger les peptides de la dégradation enzymatique. L'objectif de ce travail était de démontrer qu'un acide aminé α -méthylé portant une chaîne latérale alkylamine pourrait subir un couplage croisé avec une halogénure d'aryle via l'amination de Buchwald-Hartwig. Des progrès ont été réalisés en vue de la synthèse de ces acides aminés à partir de la N-benzyloxycarbonyl-D-alanine.