ジアリールフランの立体的に込み合った C-H 結合の Pd 触媒による直接的アリール化反応の開発

Palladium-Catalyzed Sterically Congested C-H bond Arylations of diarylfurans.

山根 侑、山口陽水、石川慎吾、西形孝司(山口大学大学院理工学研究科)

遷移金属触媒を用いた C-H 結合の変換反応は、複雑な骨格を有する化合物の直接的な合成手法の一つとして挙げられる。近年ではより複雑な分子の構築を目指して、芳香環上にカルボニル基やアミド基といった官能基を導入することによって、oもしくは m位の C-H 結合を活性化させた位置選択的な反応の開発が盛んである(Scheme 1a) 1)。その一方で、同様に必要とされる、立体的に込み合った位置の直接的な C-H 結合の変換方法の開発は、殆ど検討が行われていない(Scheme 1b) 2)。

(a) Regioselective C(sp²)-H Functionalization (b) Congested C(sp²)-H Functionalization

Scheme 1

そこで本研究では、Pd 触媒を用いた三置換フランの立体的に込み合った 4 位の C-H 結合を対象にした直接的アリール化反応に着手した。各種反応の検討を行ったところ、 $PdCl_2/dcype/Ag_2O/AgOAc$ を用いた反応系によって、目的のトリアリールフラン 3 を最大 80%の収率で与えることを見出した。またより立体的に混み合った 1 および 2 を用いた場合でも、配位子を PCy_3 に変更することで、7 割程度の収率で目的化合物 3 が得られた($Scheme\ 2$) 3 。

Scheme 2

<参考文献>

- 1) (a) Yuhong. Z. et al. Org. Chem. Front., **2015**, 2, 1107. (b) Jiong Yang. Org. Biomol. Chem., **2015**, *13*, 1930.
- 2) (a) Itami. K. et al, Chem. Sci., **2012**, *3*, 2165. (b) Chatani. N. et al, J. Am. Chem. Soc., **2015**, 137, 12211.
- 3) Nishikata, T.; Yamane, Y.; Yamaguchi, Y.; Ishikawa, S. *Asian, JOC.* Accepted. DOI: 10.1002/ajoc.201600057.

発表者紹介

氏名 山根侑(やまねゆう)

所属 山口大学大学院理工学研究科

学年 博士後期課程2年 研究室 有機化学研究室

