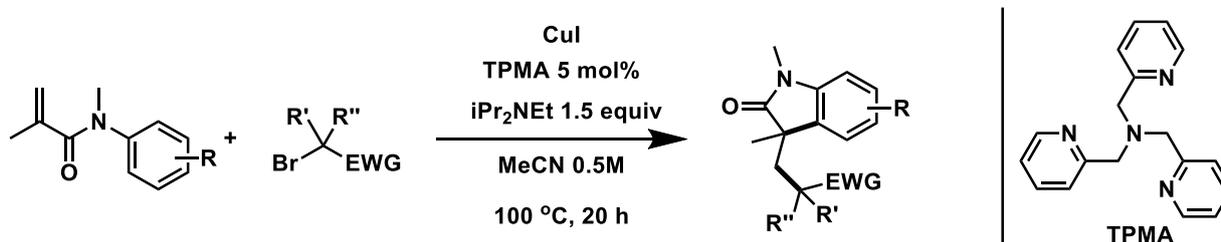




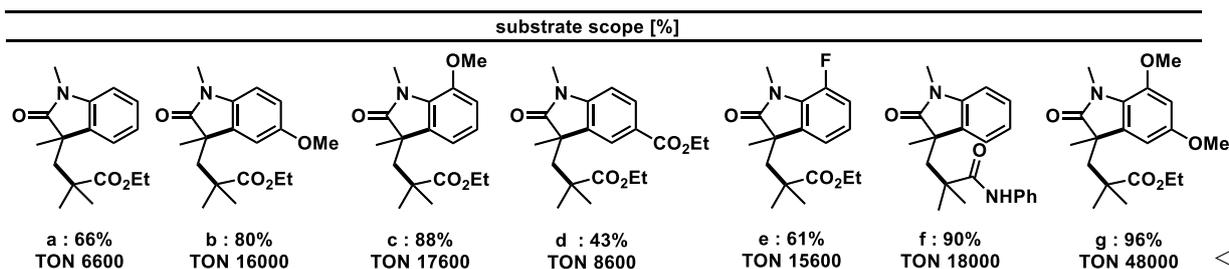
高効率銅触媒連続的第3級アルキル化—C-H 環化 Highly efficient Cu-catalyzed tandem Tertiary-alkylation-C-H cyclization

椿 直也、吉永 浩平、西形 孝司（山口大学大学院創成科学研究科）

アルケンのアルキル化は新たな炭素-炭素結合を形成する反応として、医薬品や材料の合成などで用いられている。今回はそのアルケンのアルキル化による C-H 環化反応によって合成されるオキシインドールを考える。オキシインドールの合成する方法はさまざま多く研究され報告例があるが、金属触媒の当量が少なければ合成されないといった問題点がある。この問題を解決するために、以前我々の研究室で報告した TPMA という配位子と安価な銅触媒系で高触媒回転効率に反応することを報告している。この触媒条件を用いてオキシインドールを高触媒回転率的に合成することができるのではないかと考えたので詳細について報告する。



銅触媒の触媒回転数について銅の等量を 0.05 mol% から 5 ppm からまで各種検討したところ、CuI 0.002 mol% の時 GC-MS 収率で最高の 94% (TON 47000) を達成した。また、様々な基質を検討を行い、b、c のようなメトキシ基を有する電子供与基を用いた良好な収率で反応が進行し、e のようなフッ素を有する場合でも 61% の収率で反応が進行した。d のようなエステルを有する電子求引基を用いた場合でも 43% の収率で反応が進行した。最適化した条件で最高で TON 48,000 が得られた。本発表では、想定している反応機構や各検討結果の詳細についても併せて報告する。



参考文献 >

1) Noda Y.; Nishikata T. *Chem. Commun.* **2017**, 53, 5017-5019.

発表者紹介

氏名 椿 直也 (つばき なおや)
 所属 山口大学大学院 創成科学研究科
 化学系専攻
 学年 博士前期課程 1 年
 研究室 有機化学研究室

