

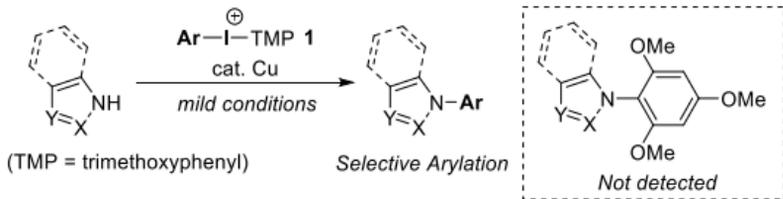
27PA-am003S

新規ジアリールヨードニウム塩を用いる効率的アリール化法 ～N-ヘテロ環への芳香環選択的C-Nカップリング反応～

○小関 大地¹, 青砥 絵里佳¹, 渡邊 和真¹, 土肥 寿文¹, 北 泰行² (¹立命館大薬, ²立命館大総研)

【背景】ジアリールヨードニウム塩はヨードアレーン部位が高い脱離能を示すことから、有用なアリール化剤として天然物合成に広く利用されている。一方、非対称なジアリールヨードニウム塩を用いる場合、反応する芳香環の選択性を制御することが重要となる。これに加えて、銅触媒を用いるN-アリール化反応では過剰反応等も問題となる。このような背景下、今回我々は芳香環補助基としてトリメトキシフェニル基 (TMP) を有するジアリールヨードニウム塩を利用した芳香環選択的なアリール化法の開発を行った。

【結果】当研究室で以前に見出した手法¹⁾により $\text{ArI}(\text{OAc})_2$ とトリメトキシベンゼンから TMP を有するジアリールヨードニウム塩 **1** を種々合成した。続いて、銅触媒存在下、²⁾N-アゾール類とヨードニウム塩 **1** を反応させたところ、温和な条件で反応が進行し、トリメトキシフェニル化生成物を与えることなく、収率良く選択的なアリール化生成物が得られた。本法について、様々なN-ヘテロ環化合物やメタルフリー条件への応用を検討したので併せて報告する。



1) T. Dohi, Y. Kita *et al.* *Tetrahedron* **2010**, *66*, 5575.

2) Z.-C. Chen *et al.* *Synth. Commun.* **2002**, *32*, 903.