

日本薬学会 第 141 年会 – Pd 触媒下で行う 5 価アンチモン試

薬とベンゾフランを用いた α 位選択的 C–H アリール化反応

○北村有希

愛知学院大学大学院薬学研究科医療薬学専攻薬化学研究室

【概要】

2021 年 3 月 28 日、オンライン(広島)で開催された「日本薬学会 第 141 年会」に参加し、以下の研究内容をポスター発表した。

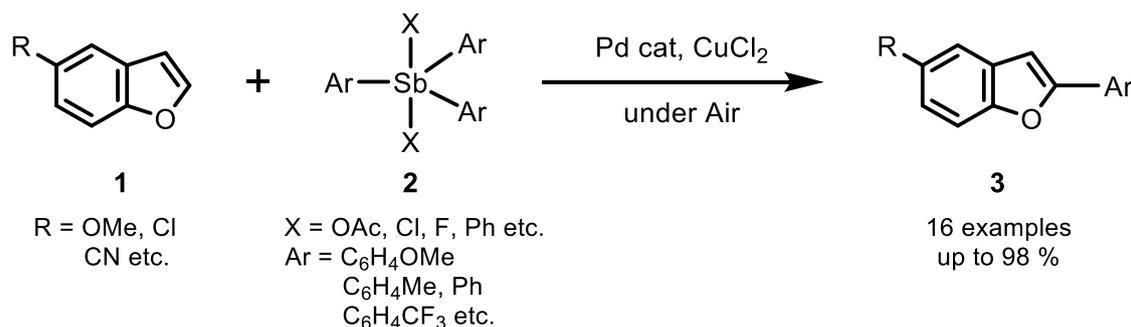
【目的】

2-アリールベンゾフランを構成成分に持つ多くの化合物に生理活性が見出され、創薬を指向した研究が活発的に行なわれている。そのため、2-アリールベンゾフラン誘導体の合成法も数多く報告され、その中に Pd 触媒下で行うベンゾフラン類に対する C–H アリール化反応がある。この反応では、精密有機合成に利用可能なアリール基供与体の開発が着目され、これまでに臭化アリール、アリールボロン酸、塩化アリールスルホニル、超原子価ヨウ素、*N*-アシルアリールヒドラジンなどを利用した反応が報告されている。近年、我々は 5 価有機アンチモン(Ar_3SbF_2)がチオフエンの C–H アリール化反応に有効なことを見出し、報告した。

そこで今回、有機アンチモン(Sb)試薬のアリール基供与能を明らかにする目的で同族複素環のベンゾフランに対する C–H アリール化反応を行った。

【結果と考察】

まず、塩化銅存在下、 $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ を触媒に用いてベンゾフランと 11 種の Sb 試薬(Ph_3SbF_2 , $\text{Ph}_3\text{Sb}(\text{OAc})_2$, Ph_5Sb など)との反応を空気雰囲気下で行った。その結果、いずれの Sb 試薬でも α 位選択的に反応が進行し、特に Ph_3SbF_2 を用いた場合に 90% と最も高収率で 2-フェニルベンゾフランが得られることが明らかとなった。次に、基質適応範囲の検討を行った。その結果、各種の Ar_3SbF_2 との反応では電子供与基が置換した場合に反応性が高くなることが明らかとなった。また、置換ベンゾフランとの反応では置換基の効果は見られず、電子供与基・求引基いずれが置換した場合も満足のいく収率で目的の 2-アリールベンゾフ



ラン誘導体(3)を得ることができた。これに対して、ベンゾフランの同族複素環であるベンゾセレノフェンやテルロフェンとの反応も試みたが、アリアル化は進行しなかった。

【感想】

今回は新型コロナウイルスの関係で、オンラインでの学会発表を初めて経験することができました。Web ポスター掲示に対する

質疑や示説時間内のチャット機能などでの質問・アドバイスをいただいたりすることで、改めて自分の研究を見直すことができました。また、日本薬学会年会ということもあってたくさんの高度な研究内容の発表を聞いて、刺激を受けました。今後、自分の研究の参考にできたらと思いました。

最後になりましたが、このような機会を与えていただいた愛知学院大学薬学会に感謝いたします。