

|      |               |
|------|---------------|
| 研究区分 | 教員特別研究推進 地域振興 |
|------|---------------|

|       |   |       |               |    |       |
|-------|---|-------|---------------|----|-------|
| 研究テーマ | 1 <i>H</i> ピロール類の位置選択的アリール化と多置換ピロリジン類およびピロリン類への変換 |       |               |    |       |
| 研究組織  | 代表者   | 所属・職名 | 薬学部・助教        | 氏名 | 山口 深雪 |
|       | 研究分担者   | 所属・職名 | 岐阜薬科大学薬学部・准教授 | 氏名 | 井川 貴詞 |
|       |   | 所属・職名 |               | 氏名 |       |
|       |   | 所属・職名 |               | 氏名 |       |
|       | 発表者   | 所属・職名 | 薬学部・助教        | 氏名 | 山口 深雪 |

|                 |  |
|-----------------|--|
| 講演題目            | 1 <i>H</i> ピロール類の位置選択的アリール化と多置換ピロリジン類およびピロリン類への変換  |
| 研究の目的、成果及び今後の展望 | <p>本研究では、従来の基質の性質による位置選択性制御に代えて、金属と配位子から成る触媒を用い、<b>配位子により位置選択性を制御</b>することで入手容易な 1<i>H</i>ピロールから様々なアリール化ピロール類を選択的に合成することを目指した。これにより、配位子を使い分けると、複数の反応点を持つ基質において位置選択的に反応が進行し、単純な 1<i>H</i>ピロールから、<b>2<i>H</i>ピロール</b>、<b>3<i>H</i>ピロール</b>などの合成例の少ない骨格を含む様々な置換化合物を得ることが可能となる。さらにそれらを変換し、<b>多置換ピロリン</b>、<b>多置換ピロリジン</b>などの様々な多置換化合物の合成への展開を目指し検討を行った。</p> <p>始めに、3,4-二置換 1<i>H</i>ピロールの C3 位脱芳香族的アリール化による 3<i>H</i>ピロール類の合成を検討した。様々な配位子を用いて反応条件の検討を行ったが、N 位でアリール化が進行し、目的の C3 位がアリール化 3<i>H</i>ピロールは得られなかった (スキーム a)。また、3-置換 1<i>H</i>ピロールについても同様に反応を行ったが、この場合にも N 位でアリール化が進行することが明らかとなった。</p> <p>続いて、無置換 1<i>H</i>ピロールの C3 位選択的アリール化を行った。塩基に <i>t</i>-BuOLi、さらに適切な配位子を用いることで C3 位で優先して反応が進行した (スキーム b)。</p> <p>また、2,3,5-三置換 1<i>H</i>ピロールの C2 位/C5 位アリール化による四置換 2<i>H</i>ピロール合成を検討し、収率に改善の余地はあるものの目的物を得た (スキーム c)。</p> <p>さらに、2,2,5-三置換 2<i>H</i>ピロールの還元反応条件を精査し、適切な条件の選択により、還元的位置選択性および目的物の収率が向上した (スキーム d)。</p> <p>本研究で得られた知見により、従来困難だった位置での選択的反応が実現し、化合物ライブラリーを始めとする、多様な構造および置換パターンを有する化合物群の迅速かつ効率的合成につながると期待される。</p> |

