

アミノアルコール有機分子触媒を用いるピロール類とエノン類との不斉 Friedel-Crafts アルキル化

(室蘭工大¹・室蘭工大院工²・東北医薬大³・東北大院理巨大研セ⁴・ときわ会⁵)

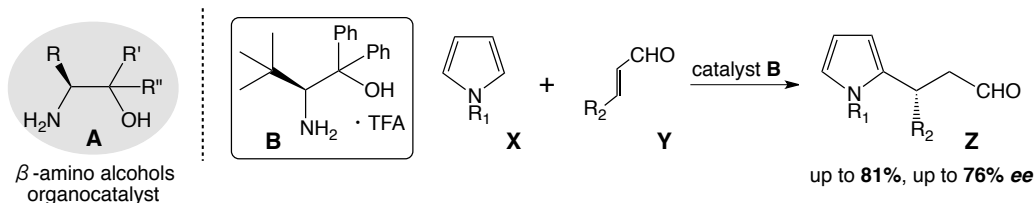
○渡辺 敦也¹・Zubeda Begum²・関 千草²・奥山 祐子³・権 垠相⁴・上井 幸司²
・常盤 峻士⁵・常盤 傑⁵・竹下 光弘⁵・中野 博人²

Asymmetric Friedel-Crafts alkylation of pyrroles with enones using amino alcohol organocatalyst (¹Muroran Institute of Technology, ²Graduate School of Engineering, Muroran Institute of Technology, ³Tohoku Medical and Pharmaceutical University, ⁴Graduate School of Science, Tohoku University Research and Analytical Center for Giant Molecules, ⁵Tokiwakai Group) ○Atsuya Watanabe,¹ Zubeda Begum,² Chigusa Seki,² Yuko Okuyama,³ Eunsang Kwon,⁴ Koji Uwai,² Michio Tokiwa,⁵ Suguru Tokiwa,⁵ Mitsuhiro Takeshita,⁵ Hiroto Nakano²

The development of a chiral organocatalyst is very important for obtaining a chiral product with a high optical purity in a catalytic asymmetric reaction. Recently, we developed chiral amino alcohols **A** as an organocatalyst showing high levels of catalytic activities in some asymmetric reactions¹⁾. This catalyst has two advantageous features such as amino group acting as covalent or basic sites and hydroxyl group acting as non-covalent hydrogen bonding site in the single molecule. In this study, we demonstrated that the asymmetric Friedel-Crafts alkylation of pyrroles **X** with α,β -unsaturated aldehydes **Y** to generate β -pyrrolyl carbonyls **Z** as useful synthetic intermediates for the construction of variety of biomedical agents. As a result, the catalyst **A** · TFA salt **B** showed good chemical yields (up to 81%) and with good stereoselectivities (up to 76% *ee*). The detail of this work will be reported.

Keywords : Organocatalyst; Friedel-Crafts Alkylation; Amino Alcohol; Pyrrole; Enone

不斉反応中で、高い光学純度で目的の生成物を得るための新規有機分子触媒の開発は大変重要である。最近我々は、アミノアルコール有機分子触媒 **A** を開発し、触媒 **A** が様々な不斉反応において優れた不斉触媒機能を発現することを明らかにしている¹⁾。本触媒は、分子中に共有結合部位または塩基性部位として機能するアミノ基、さらに非共有結合部位として水素結合形成に有効な水酸基を有する多点認識型触媒である。本研究では、アミノアルコール有機分子触媒 **A** の機能性を拡張することを目的として、触媒 **A** の TFA 塩を用いるピロール誘導体 **X** とエノン類 **Y** との不斉 Friedel-Crafts アルキル化を検討した。その結果、触媒 **B** が本反応において不斉触媒活性を示し、目的とするキラルなピロール生成物 **Z** が良好な化学収率 (up to 81%) とエナンチオ選択性 (up to 76% *ee*) で得られた。これら結果の詳細について報告する。



- 1) U.V. Subba Reddy, M. Chennapuram, C. Seki, E. Kwon, Y. Okuyama, K. Uwai, M. Tokiwa, M. Takeshita, H. Nakano, *Eur. J. Org. Chem.*, **2016**, *24*, 4124.