

## イリジウム触媒によるピロールならびにインドールの C2 位の形式的 C-H 不斉共役付加

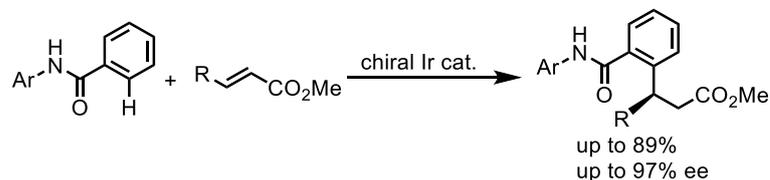
(早大先進理工) ○佐々木 美桜・小島 雅史・伊藤 守・柴田 高範  
 Iridium-Catalyzed Enantioselective Formal C-H Conjugate Addition of Pyrrole and Indoles at Their C2 Positions (School of Advanced Science and Engineering, Waseda University) ○Mio Sasaki, Masafumi Kojima, Mamoru Ito, Takanori Shibata

Transition metal-catalyzed C-C bonds formation via C-H bond activation is one of the most effective strategies because of high atomic efficiency. The strategy has attracted much attention in recent years. We have already achieved an enantioselective C-H alkylation to the *ortho* position of benzanilide derivatives with  $\beta$ -substituted  $\alpha,\beta$ -unsaturated esters.<sup>1)</sup>

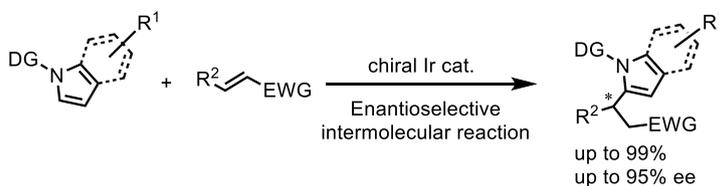
We here examined C-H activation using pyrrole and indole derivatives as substrates. After condition screening, formal C-H conjugate addition to enones proceeded in high yield with high enantioselectivity.

**Keywords:** Iridium Catalyst; C-H Bond Activation; Enantioselective Synthesis; Pyrrole; Indole

遷移金属触媒による C-H 結合活性化を用いた C-C 結合の形成は、高い原子効率や工程数の低減の観点から非常に有効な手法の一つであり、近年盛んに研究されている。我々はキラルなカチオン性イリジウム触媒を用いてベンズアニリド誘導体の芳香族  $sp^2$  C-H 結合を活性化し、形式的な不斉共役付加反応を達成した<sup>1)</sup>。この反応ではベンズアニリド基質のカルボニル側のオルト位で選択的に反応が進行する。



今回、我々は窒素上に配向基 (DG) を有するピロール誘導体を基質とした反応を行った結果、ピロール C2 位での C-H 不斉付加反応が進行した。種々の条件検討の結果、キラルイリジウム触媒を用いた電子不足アルケンとの反応が高収率、高エナンチオ選択的に進行し、不斉 C-H 付加体が得られた。本反応ではピロール誘導体に加え、インドール誘導体も基質に用いることが可能であり、多置換インドール化合物が得られた。



- 1) T. Shibata, H. Kurita, S. Onoda, K. S. Kanyiva, *Asian J. Org. Chem.* **2018**, 7, 1411-1418.
- 2) T. Shibata, M. Sasaki, M. Kojima, M. Ito, *Org. Lett.* **2021**, 23, 9078-9082.