アリールスルホキシドとフェノールのカップリングによるビアリ ールの合成

(京大院理)○若林 亮汰・深澤 瑞喜・依光 英樹 Synthesis of Biaryls via Coupling of Aryl Sulfoxide with Phenol (*Graduate School of Science, Kyoto University*) ○Ryota Wakabayashi, Mizuki Fukazawa, Hideki Yorimitsu

Biaryls represent an important class of skeletons that are often found in bioactive molecules as well as functional materials. Previously, we reported the reaction of aryl sulfoxides with phenols by means of trifluoroacetic anhydride (TFAA) to synthesize the corresponding biaryls through the activation of aryl sulfoxides with the anhydride. The reaction efficiently constructs the new carbon–carbon bond between the ortho positions of aryl sulfoxide and phenol. However, several issues are to be addressed, especially about the use of strong activators such as TFAA and the poor regioselectivity when unsymmetrical substrates are used. We assume that the alkyl chains in aryl alkyl sulfoxides and/or phenols would affect the efficiency and selectivity of the reaction. We thus report our investigation about the effects of alkyl chains on the reaction.

Keywords: Aryl Sulfoxide, Sigmatropic rearrangement, Biaryl compound, Phenol

ビアリールは生物活性物質や機能性有機材料によくみられる重要な骨格である。以前我々は、アリールスルホキシドをトリフルオロ酢酸無水物(TFAA)で活性化しフェノールと反応させると、アリールスルホキシドとフェノールのオルト位で結合生成が効率よくおこり、対応するビアリールが得られることを報告した 11 。しかし本反応は、TFAAのような反応性の高い酸無水物が必要であること、ならびに、非対称な基質を用いた時の位置選択性が課題であった。我々は、アリールスルホキシドならびにフェノール上のアルキル基 \mathbf{R}^{1} , \mathbf{R}^{2} がこのビアリール合成法の効率と位置選択性を向上させるのではないかと考えた。本講演では、アルキル基が収率や選択性に与える影響について検討したので報告する。

$$R^2$$
 Activator R^2 OH R^2 Activator R^2 OH R^2 OH

1) T. Yanagi, S. Otsuka, Y. Kasuga, K. Fujimoto, K. Murakami, K. Nogi, H. Yorimitsu, A. Osuka, *J. Am. Chem. Soc.* **2016**, *138*, 14582.