

キラルリン酸を用いた芳香族求電子置換反応による 軸不斉 *N*-アリールピロールの合成

(学習院大理) ○大作 宇宙・内倉 達裕・秋山 隆彦

Synthesis of Axial *N*-arylpyrroles by Electrophilic Aromatic Substitution Reaction with Chiral Phosphoric Acid (*Fuculty of Science, Gakushuin University*)

○Sora Osaku, Tatsuhiro Uchikura, Takahiko Akiyama

Axially chiral *N*-arylpyrroles are often found in biologically active substances, chiral catalysts, and chiral ligands. Therefore, their synthesis has become one of the most important research fields in synthetic organic chemistry and has been actively investigated in recent years. In this study, we developed an enantioselective synthesis of axially chiral *N*-arylpyrroles via an aromatic electrophilic substitution reaction for achiral *N*-arylpyrroles using chiral phosphoric acid. Upon, achiral *N*-arylpyrroles were treated with diester azodicarboxylate as an electrophile in the presence of chiral phosphoric acid, the desired axially chiral *N*-arylpyrroles were obtained in up to 97% yield with 95% ee.

Keywords : *Chiral Phosphoric Acid; N-arylpyrrole; Axial Chirality; Asymmetric Synthesis; Biaryl Compound*

軸不斉 *N*-アリールピロールは、生理活性物質や不斉触媒、不斉配位子等に多く見られる。そのため、それらの合成は有機合成化学において重要な研究分野の一つとなっており、近年活発に研究が行われている。本研究では、キラルリン酸を用いたアキラルな *N*-アリールピロールに対する芳香族求電子置換反応による軸不斉 *N*-アリールピロールのエナンチオ選択的合成を達成した。

すなわち、アキラルな *N*-アリールピロールに対し、求電子剤としてアゾジカルボン酸ジエステルをキラルリン酸存在下で作用させたところ、最高 97% 収率、95% ee で目的の軸不斉 *N*-アリールピロールが得られた。

