

NHC 触媒を用いたクロモン 2 位の直接的アロイル化反応

(上智大理工¹⁾ ○小山楓汰¹・高橋玲衣¹・藤田正博¹・鈴木由美子¹

NHC-catalyzed Direct Aroylation at Position 2 of Chromones (¹*Fac. Sci. Technol., Sophia Univ.*) ○Futa Koyama,¹ Rei Takahashi,¹ Masahiro Fujita,¹ Yumiko Suzuki²

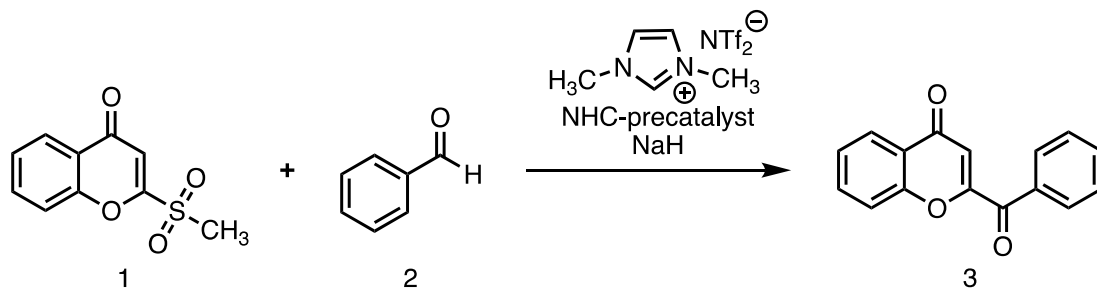
Chromones are important structural motifs in natural product and pharmaceutical chemistry. Thus, functionalization of the scaffold is of special synthetic importance. The reported route to access 2-acyl chromones consists of multiple reaction steps and requires more than an equimolar of expensive heavy metal reagents.¹⁾ We present NHC-catalyzed reaction²⁾ to introduce aroyl groups originating from aromatic aldehydes to position 2 of chromone derivative **1** in the presence of NHC (10 mol %) in acetonitrile at room temperature to afford the corresponding aroyl chromone **3**. The starting material 2-methylsulfonylchromones can be easily synthesized in 2 steps from commercially available compounds which makes this transformation valuable.

Keywords : *N*-heterocyclic carbene; Aroylation; Umpolung; Chromone; Organocatalyst

クロモン類は天然有機化合物や、抗腫瘍活性や抗菌活性物質などの基本骨格として重要であるため、その官能基化は有用である。我々は、含窒素複素環式カルベン(NHC)を触媒としたクロモン 2 位の直接的アロイル化反応を開発した。

クロモン環 2 位へのアシル化反応の報告例は少なく、多段階や等量以上の金属種を必要としていた¹⁾。そこで、容易に合成可能なメチルスルホニル体 **1** を基質とし、NHC 触媒反応²⁾により芳香族アルデヒド由来のアロイル基を 2 位に一段階で導入する反応の検討を行った。

実際に、クロモン誘導体 **1** とベンズアルデヒド **2** の反応を、アセトニトリル中、塩基性条件下、NHC 前駆体 10mol%を使用して行なうと、目的の誘導体 **3** が得られた。



1) L. Klier, T. Bresser, T. A. Nigst, K. Karaghiosoff, P. Knochel, *J. Am. Chem. Soc.* **2012**, 134, 13584.

2) NHC-catalyzed aroylation at position 4 of coumarin has been reported. Y. Suzuki, A. Ando, M. Nakagawa, *Tetrahedron Lett.* **2018**, 59, 4276-4278.