

キラルリン酸を用いた第三級インドリルアルコールに対する不斉 Friedel–Crafts アルキル化反応

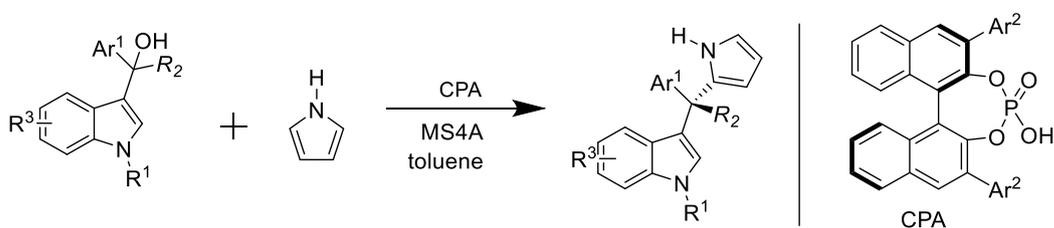
(学習院大理) ○吉村 達彦、Irene Sánchez Sordo、牧野 祐大、越阪部 寛人、内倉 達裕、秋山 隆彦

Chiral Phosphoric Acid Catalyzed Enantioselective Friedel–Crafts Alkylation Reaction of Tertiary Indolyl Alcohol (*Faculty of Science, Gakushuin University*) ○Tatsuhiko Yoshimura, Irene Sánchez Sordo, Yudai Makino, Hiroto Osakabe, Tatsuhiko Uchikura, Takahiko Akiyama

Indole derivatives containing asymmetric all carbon quaternary center are used in biologically active compounds. Therefore, the construction of asymmetric quaternary carbons is an important research topic of interest in synthetic organic chemistry. We previously reported chiral phosphoric acid catalyzed enantioselective dehydroxyhydrogenation of indolyl alcohols with hydrogen donors. In this study, we have developed asymmetric Friedel–Crafts alkylation reaction of indolyl alcohols with pyrrole to afford chiral indole derivatives bearing all carbon quaternary center with excellent enantioselectivity.

Keywords: Friedel–Crafts alkylation reaction; enantioselectivity; pyrrole; chiral phosphoric acid; indole

不斉四級炭素を有するインドール誘導体は医薬品等の生理活性物質の中に数多く存在する。従ってその不斉四級炭素の構築は有機合成化学において、重要な研究課題の一つである。不斉四級炭素の構築の際、Friedel–Crafts アルキル化反応は有用な手法の一つである。当研究室では、第三級インドリルアルコールに対しキラルリン酸存在下、水素供与体を用いることで、不斉脱ヒドロキシ水素化反応が高いエナンチオ選択性で進行することを見出している。本研究では水素供与体の代わりにピロールを用いることで Friedel–Crafts アルキル化反応が効率よく進行し、不斉四級炭素原子を有する光学活性なインドール誘導体が高い光学純度で得られることを見出した。



- 1) Osakabe, H.; Saito, S.; Miyagawa, M.; Suga, T.; Uchikura, T.; Akiyama, T. *Org. Lett.* **2020**, *22*, 2225–2229.