

ホウ素ルイス酸性を制御した有機ボロン酸を使用した鈴木-宮浦クロスカップリング反応開発

(山大院創成¹⁾) ○土屋 直輝¹・西形 孝司¹

Suzuki-Miyaura coupling with boron Lewis acidity-controlled organoboronic acid (¹Graduate School of Sciences and Technology, Yamaguchi University)

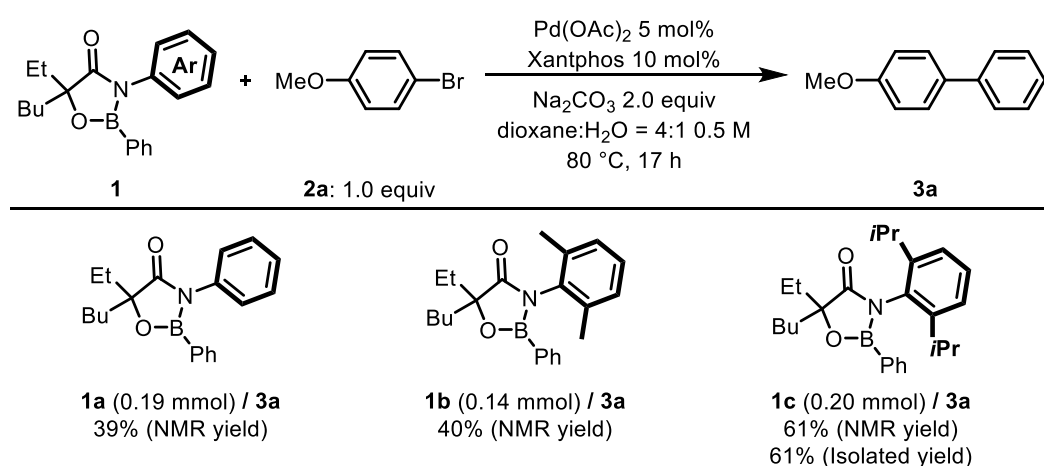
○Naoki Tsuchiya,¹ Takashi Nishikata¹

The Lewis acidity of a boron center is one of the most important factors to carry out efficient Suzuki-Miyaura couplings. In view of the importance of the Lewis acidity, various organoboron reagents possessing controlled boron Lewis acidity have been so far developed. In this research, we have developed a new organoboron reagent possessing a hydroxycarboxamide moiety, oxazaborolidine. We tested reactivities of our developed organoboron reagents in Suzuki-Miyaura coupling.

Keywords : organoboronic acid, Suzuki-Miyaura coupling, oxazaborolidine

鈴木-宮浦カップリング反応を効率的に進行させるためには、有機ボロン酸のホウ素中心のルイス酸性をコントロールすることが非常に重要である。このような観点から、これまでにホウ素中心のルイス酸性を制御した様々な有機ボロン酸試薬が開発されている¹⁾。今回我々は、ヒドロキシアミド骨格を有するオキサザボロリジンを用いた新たな有機ホウ素試薬として開発し、鈴木-宮浦クロスカップリングにおける反応性を調査した。

例えば、以下に示したようにアミド窒素上のアリール基を変化させたオキサザボロリジン **1a-c** を、4-ブロモアニソール **2a** とパラジウム触媒存在下、80℃で反応させた。その結果、アミド窒素上のアリール基の立体障害を大きくすると、鈴木-宮浦カップリング生成物 **3a** の収率を改善することができた。



1) (a) N. Miyaura, T. Yanagi, A. Suzuki, *Synth. Commun.* **1981**, *11*, 513. (b) R. A. Batey, T. D. Quach, *Tetrahedron Lett.* **2001**, *42*, 9099. (c) D. M. Knapp, E. P. Gillis, M. D. Burke, *J. Am. Chem. Soc.* **2009**, *131*, 6961.