

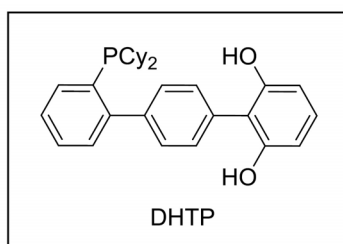
本研究では、医薬品候補化合物を始めとする種々の多置換化合物の効率的合成につながると期待される新規位置選択的反応の開発を行った。一般に広く用いられている基質の電子的性質や立体障害を利用した位置選択性制御ではなく、筆者らのグループで開発したヒドロキシ基含有ホスフィン配位子 DHTP (dihydroxyterphenylphosphine) と金属からなる触媒を用いれば、触媒による位置選択性の制御が可能となり、既存の触媒と異なる位置選択性・高い反応性を示す反応が実現すると考えた。

DHTP およびパラジウムから成る触媒を用い、ジクロロフェノールあるいはジクロロアニリン誘導体と末端アルキンのオルト位選択的菌頭カップリングを活用した二置換ベンゾフランおよびインドール合成を検討した。その結果、テトラブチルアンモニウムクロリド (TBAC) の添加によりクロロベンゾフラン/クロロインドールとボロン酸の鈴木-宮浦カップリングが促進され、基質一般性を拡大させることができた。

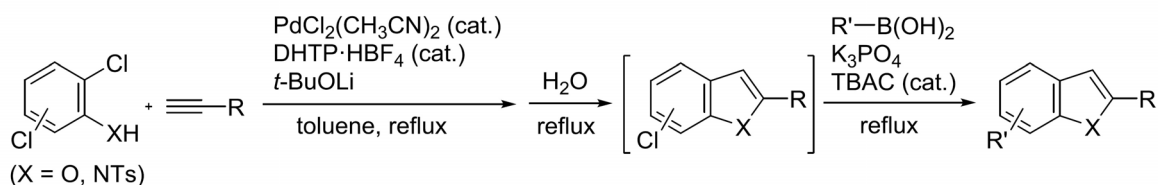
さらに同触媒を用いる新規反応の検討を行い、クロロアレーンを用いるインドールのアリール化において、既存の配位子を用いた場合と異なる位置選択性を示すことを見出した。

本研究の成果を活用することで、多様な置換パターンを有する化合物群の迅速かつ効率的合成が可能になると期待される。

#### 基質捕捉能を有する配位子 DHTP を用いる位置選択的反応



#### 1. Synthesis of disubstituted benzo[b]furans and indoles



#### 2. Arylation of indole with chloroarenes

