

3-フルオロアライン前駆体を用いる逐次アライン発生法の開発

(医科歯科大生材研¹・理研 BDR²・九大院薬³)

○西田 茅也人¹・隅田 有人¹・半矢 実保¹・田口 純平¹・丹羽 節^{2,3}・細谷 孝充^{1,2}

Sequential aryne generation from 3-fluoroaryne precursor

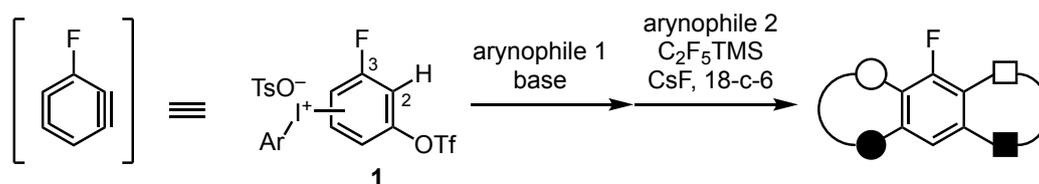
(¹Institute of Biomaterials Bioengineering, Tokyo Medical and Dental University, ²RIKEN BDR, ³Graduate School of Pharmaceutical Sciences, Kyushu University)

Kayato Nishida,¹ Yuto Sumida,¹ Miho Hanya,¹ Jumpei Taguchi,¹ Takashi, Niwa,^{2,3} Takamitsu Hosoya^{1,2}

Since arynes are useful intermediates for constructing the skeleton of multisubstituted aromatic compounds, a method for sequential aryne generation on a single aromatic ring would be a powerful method for preparing more complex multisubstituted aromatics. In this study, we have examined to develop a novel method for sequential aryne generation using a 3-fluoroaryne precursor.

Keywords : Benzyne; 3-fluoroaryne; Sequential aryne generation; Multisubstituted aromatic

アラインは多置換芳香族化合物の骨格構築に有用な中間体であるため、一つの芳香環上で連続的にアラインを発生させ、変換に利用できれば、より複雑な多置換芳香族を簡便に合成できる¹⁾。今回我々は、新たに開発した3-フルオロアラインの発生法²⁾と組み合わせることで逐次的にアラインを発生できる手法の開発に取り組んだ。具体的には、3-フルオロベンザインの前駆体である3-フルオロフェニルトリフラートに対して、異なる塩基性条件でアラインの発生が可能なヨードニウム塩³⁾を脱離基として導入したベンズジイン前駆体 **1** の合成と、それを利用した逐次アライン発生を検討した。



1) L. Yang, *et al. Chem. Soc. Rev.* **2017**, 46, 1707.

2) 前講演.

3) a) D. R. Stuart, *et al. Angew. Chem. Int. Ed.* **2016**, 55, 8431; b) P. H.-Y. Cheong, D. R. Stuart, *et al. Chem. Eur. J.* **2021**, 27, 7168; c) D. R. Stuart, *et al. Org. Lett.* **2021**, 23, 4813; d) D. R. Stuart, *et al. Chem. Sci.* **2023**, 14, 13885.