

イリジウム触媒を用いたピロール誘導体のアトロプ選択的 C-H アルキル化反応

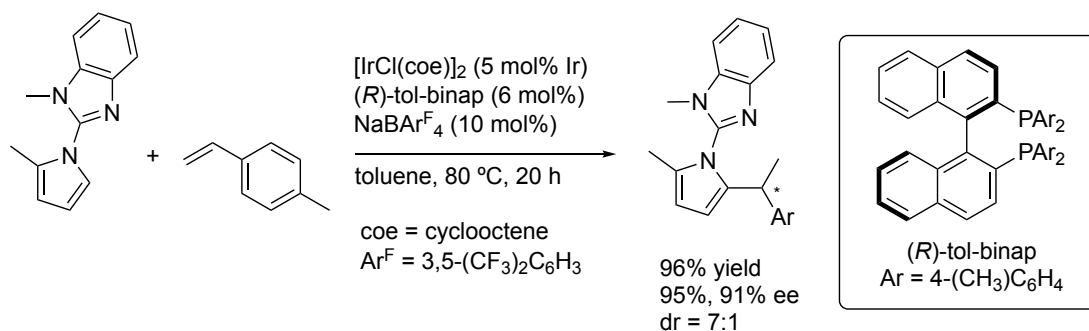
(阪公大院理¹・阪公大理²) ○山川健太郎¹・岡山優樹²・西村貴洋^{1,2}

Iridium-Catalyzed Atroposelective C-H Alkylation of Pyrrole Derivatives (¹*Graduate School of Science, Osaka Metropolitan University*, ²*Faculty of Science, Osaka City University*) ○ Kentaro Yamakawa,¹ Yuki Okayama,¹ Takahiro Nishimura^{1,2}

Axially chiral biaryls are ubiquitous and important skeletons that appear in bioactive compounds, natural products, and pharmaceuticals. Although several successful methods for synthesizing 6-membered chiral biaryls have been disclosed, methodologies for constructing 5-membered chiral biaryls have been less explored due to their low rotational barrier. Here we report iridium-catalyzed atroposelective C-H alkylation of 5-membered pyrrole derivatives. In this reaction, the C-H addition of pyrroles, which have *N*-methylbenzimidazolyl as a directing group, to the terminal alkenes proceeded in a branched selective manner. The alkylated pyrroles having a central chirality and an axial chirality derived from the C-N bond were obtained.

Keywords : *Iridium Catalyst; Atroposelective; Pyrrole Derivatives; Alkylation; Asymmetric Reaction*

軸化合物を有するキラルビアリアル骨格は生物活性化合物や天然物、医薬品に広くみられる重要な骨格である。これまで6員環軸不斉ビアリアル化合物がいくつか合成されてきた。一方、5員環軸不斉ビアリアル骨格は、その回転障壁の小ささからいまだに報告例が限られている¹⁾。今回、我々はイリジウム触媒を用いたピロール誘導体のアトロプ選択的 C-H アルキル化反応を開発した。本反応では、*N*-メチルベンズイミダゾール基を配向基とするピロール C-H 結合が末端アルケンへと分岐型選択的に付加し、中心不斉と C-N 軸に由来する軸不斉をもつ五員環化合物が得られる。



1) B. Zhou *et al.*, *Sci China Chem*, **2023**, 66, 2480–2491.