

アミン類の絶対配置決定を目指したテトラフェニルエチレン誘導体の合成

(東邦大理¹・東邦大複合物性研究セ²・千葉工大工³) ○古家詩音¹・町田隼也¹・荒木雄大¹・池田茉莉³・幅田揚一^{1,2}・白井智彦¹・桑原俊介^{1,2}

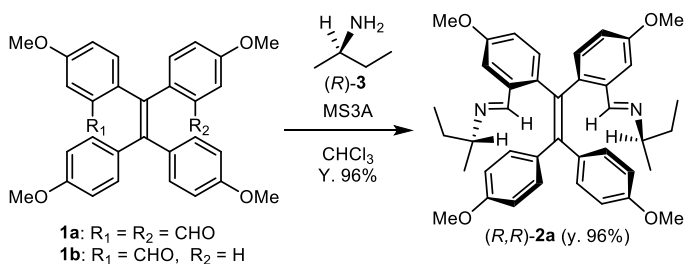
Synthesis of Tetraphenylethylene Derivatives for Determining the Absolute Configurations of Chiral Amines (¹*Department of Chemistry and* ²*Research Center for Materials with Integrated Properties, Toho University,* ³*Department of Chemistry, Education Center, Chiba Institute of Technology*) ○Shinon Furuya,¹ Shunya Machida,¹ Yudai Araki,¹ Mari Ikeda,³ Yoichi Habata,^{1,2} Tomohiko Shirai,¹ Shunsuke Kuwahara^{1,2}

Chiral amines are important in the fields of pharmaceuticals, foods, fragrances, and functional materials, and accurate, rapid, and simple methods for determining their absolute configuration and optical purity are desired. Recently, we have reported a tetraphenylethylene (TPE) derivative (**1a**). The linkage (**2a**) formed by reacting the two formyl groups of **1a** with a chiral amine exhibits a characteristic CD spectrum, and the absolute configuration of the amine can be determined. However, the enantiomeric excess (%ee) of the amines was difficult to determine because of the different reactivities of *S*- and *R*-amines towards 1:1 adduct of **1a** and amines.

Here, we will report a synthesis of TPE derivative (**1b**) with one formyl group. **1b** was synthesized by sequential haloallylation/Suzuki-Miyaura cross-coupling using 2-formyl-4-methoxyphenylboronic acid, 4-iodoanisole, and bis(4-methoxyphenyl)acetylene. We will also report the coupling reaction of **1b** with chiral amines.

Keywords : *Determination of the absolute configuration, Chiral Amine, Tetraphenylethylene, CD Spectrum*

キラルアミン類は医薬品、食品、香料、機能性材料の分野で重要であり、その絶対配置や光学純度を正確、迅速、簡便に決定できる方法が望まれている。近年我々は、テトラフェニルエチレン(TPE)誘導体(**1a**)を合



成した。**1a**の2つのホルミル基とキラルアミンを反応させた連結体は特徴的なCDスペクトルを示し、アミンの絶対配置を決定できることを報告した。しかし2当量以上のアミンが必要なこと、連結反応の中間体である**1a**とアミンの1:1付加体に対する*S*-アミンと*R*-アミンの反応性が異なるため、エナンチオマー過剰率(%ee)の決定ができないことに課題があった。

今回1つのホルミル基をもつTPE誘導体(**1b**)を設計した。**1b**は2-ホルミル-4-メトキシフェニルボロン酸、4-ヨードアニソール、ビス(4-メトキシフェニル)アセチレンを用いた連続的ハロアリル化/鈴木-宮浦クロスカップリングによって合成することに成功した。**1b**とキラルアミンとの連結反応についても報告する予定である。