

3-ヨード-2*H*-クロメン合成法の開発

(神戸大院農¹, 神戸大農², 阪公大院理³) 姜法雄¹, ○豊口樹², 佐藤哲也³

Development of Synthesis Method of 3-Iodo-2*H*-chromene (¹*Graduate School of Agricultural Science, Kobe University*, ²*Faculty of Agriculture, Kobe University*, ³*Graduate School of Science, Osaka Metropolitan University*) Bubwoong Kang,¹ ○Itsuki Toyoguchi,² Tetsuya Satoh³

Isoflavones are a group of compounds widely found in natural products and their synthetic intermediates, exhibiting significant biological activity. As a result, many synthetic methods for isoflavones have been developed. Among these, the cross-coupling of the AC- and B-ring units is a particularly valuable strategy for obtaining a variety of derivatives. In this approach, 2*H*-chromene bearing a functional group at the 3-position is utilized as the AC-ring unit. While 3-iodo-2*H*-chromene is a promising candidate as the AC-ring unit, its synthesis has not been reported to date. Recently, we reported an efficient method for the synthesis of 3-cyano-2*H*-chromene.^a In the present study, we report the conversion of the cyano group in 3-cyano-2*H*-chromene into a carboxyl group via hydrolysis, followed by Larrosa's decarboxylative-iodination reaction,^b to 3-iodo-2*H*-chromene, a promising new synthetic building block.

Keywords : *isoflavonoid; chromene; natural product; total synthesis; decarboxylative-iodination*

イソフラベンは生物活性を示す天然物やその合成中間体に広くみられる化合物群である。そのためイソフラベンの合成法は数多く開発されてきた。その中でも多様な誘導体を得るための有用な合成法として、AC 環ユニットと B 環ユニットのクロスカップリングが挙げられる。この手法では、3 位に官能基を持つ 2*H*-クロメンを AC 環ユニットとして用いる。AC 環ユニットとして 3-ヨード-2*H*-クロメンは有望であるが、その合成は報告されていない。ところで、我々は近年 3-シアノ-2*H*-クロメンを効率的に合成する手法を報告した^a。そこで、本研究では 3-シアノ-2*H*-クロメンのシアノ基を加水分解によりカルボキシル基へと変換し、続けて Larrosa らの脱カルボキシル化を伴うヨウ素化反応^bにより新たな合成素子として期待できる 3-ヨード-2*H*-クロメンへと変換することができたので報告する。



- a) Efficient synthesis of 3-cyano-2*H*-chromenes using 4-Dimethylaminopyridine (DMAP) has been reported. B. Kang, K. Ikeda. *Chem. Pharm. Bull.* **2023**, *71*, 318–325.
- b) Transition-metal-free decarboxylative iodination reaction has been reported. I. Larrosa, G. J. P. Perry. *J. Am. Chem. Soc.* **2017**, *139*, 11527–11536.