

フォスファゼン塩基によるケイ素化求核剤の求核置換反応

有機触媒のみを用いて、効率よく置換ベンゼン誘導体、置換芳香族ヘテロ環化合物を合成可能

概要

求核反応部位がトリアルキルシリル基で保護されたシリル求核剤の脱シリル化による求核反応が、有機合成において様々な場面で用いられてきた。脱シリル化のためにTBAFやDBUが用いられてきたが、脱シリル化可能な有機ケイ素化合物の範囲には制限があるとともに、生成するアニオンの求核性も十分とは言いがたい。本発明は、より強力な活性化法およびより反応性の高いアニオンの生成により、高効率・高収率で求核反応を達成するものである。合成方法の一例を図表に記す。図の反応式に示すように、p-メキシフェニルTBSエーテルを用い、電子求引基を持つフルオロベンゼン誘導体に対する一連の芳香族求核置換反応を行った。結果を表にまとめた。

効果・応用例

重金属触媒の残存の恐れのない、有機触媒のみを用いて、効率よく医薬品の合成中間体である置換ベンゼン誘導体、置換芳香族ヘテロ環化合物を合成が可能することができる。

特許データシート

特許番号: 特許第3864199号
発明者: 根東 義則、上野 正弘



entry	3	X	Y	catalyst	solvent	temp (°C)	time (h)	4	Yield (%)
1	a	H	COOEt	tBu-P4 base	DMSO	80	2	a	95
2	a	H	COOEt	BEMP	DMSO	80	2	a	1
3	a	H	COOEt	DBU	DMSO	80	2	a	0
4	b	H	CN	tBu-P4 base	DMSO	100	4	b	92
5	c	H	CF ₃	tBu-P4 base	DMSO	100	10	c	93
6	d	Br	H	tBu-P4 base	DMF	100	48	d	98
7	e	I	H	tBu-P4 base	DMF	100	48	e	47

連絡先

株式会社 東北テクノアーチ
TEL 022-222-3049 FAX 022-222-3419
問い合わせは、[こちら](#)からお願いします。