

## 6-アリール-1,2,3-トリアジン-4-カルボン酸エステルの[4+2]環化反応による6-アリール-ピリダジン-3-アミン誘導体の合成

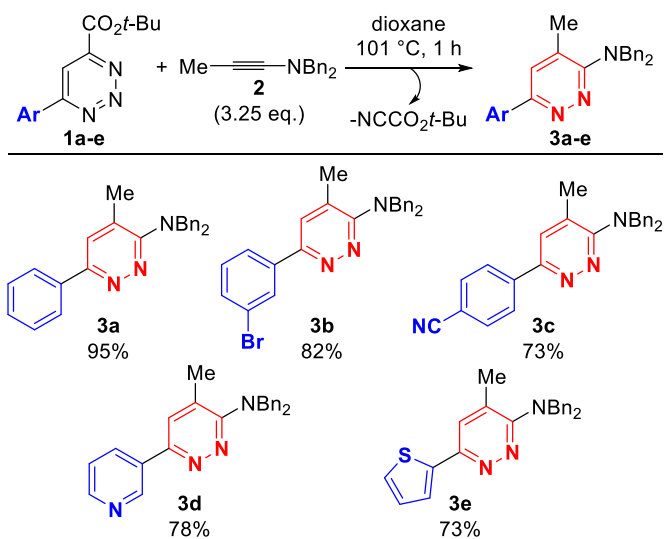
(青山学院大院理工) ○小玉 敬之・佐々木 郁雄・杉村 秀幸

Synthesis of 6-aryl-pyridazine-3-amine derivatives by the [4+2] cycloaddition of 6-aryl-1,2,3-triazine-4-carboxylates (*Graduate School of Science and Engineering, Aoyama Gakuin University*) ○Takayuki Kodama, Ikuo Sasaki, Hideyuki Sugimura

[4+2] Cycloaddition reaction of 6-aryl-1,2,3-triazine-4-carboxylates and 1-aminoalkynes was examined. The reaction of triazine derivatives bearing various substituted phenyl groups as well as 3-pyridyl, 2-thienyl, and 2-naphthyl groups at the 6-position with *N,N*-benzyl-1-propyn-1-amine in refluxing dioxane afforded the corresponding pyridazine derivatives in good yields (14 examples).

**Keywords** : 1,2,3-Triazine Derivatives; [4+2]Cycloaddition; 1-aminoalkynes; Pyridazine Derivatives

1,2,3-トリアジン誘導体は、逆電子要請型 Diels-Alder 反応において、高い求電子性を持つアザジエンとして広く利用されている。例えば、電子豊富なジエノフィルであるイナミン誘導体と反応させることでピリジンやピリダジン誘導体を得られることが報告されている<sup>1)</sup>。前年度、1,2,3-トリアジン誘導体 **1a** とイナミン誘導体 **2** をジオキサン溶媒中還流条件下で反応させることで、[4+2]付加環化反応と引き続くシアノギ酸エステルの脱離によりピリダジン誘導体 **3a** のみが高収率で得られることを報告した<sup>2)</sup>。本研究では、この反応によって得られるピリダジン誘導体 **3** の基質適用範囲拡大を検討した。アリール基としてハロゲン置換フェニル基や種々の電子求引性基や電子供与性基が置換したフェニル基、またチオフェンやピリジンをアリール基として持つトリアジンをを用いて反応を行った。その結果、いずれも収率良く相当するピリダジン誘導体を得ることができた。また、トリアジンとイナミンとの[4+2]付加環化反応を利用した生物活性を有するピリダジンの合成についても併せて報告する。



1) D. Boger *et al.* *Org. Lett.* **2014**, *16*, 5084-5087

2) 小玉敬之, 松澤明日香, 佐々木郁雄, 杉村秀幸, 日本化学会 第 100 春季年会, **2020**, 1H4-46