

テトラアリアルホスホニウム塩触媒によるエポキシドとトリクロロアセトニトリルの形式的[3+2]反応を利用したβ-アミノアルコール合成

(信州大工) ○塩川 亮太・戸田 泰徳・菅 博幸

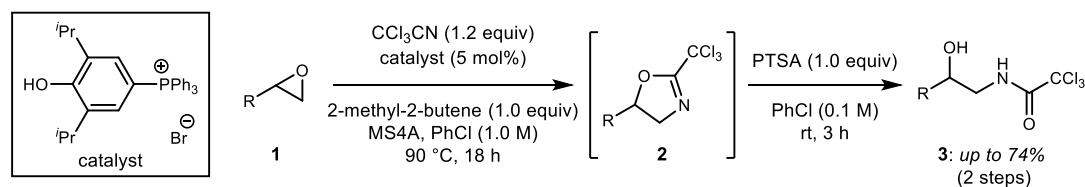
Tetraarylphosphonium salts-catalyzed formal [3+2] cycloaddition between epoxides and trichloroacetonitrile for the synthesis of β-amino alcohols (*Department of Materials Chemistry, Faculty of Engineering, Shinshu University*) ○Ryota Shiokawa, Yasunori Toda, Hiroyuki Suga

Amino alcohols are not only useful as building blocks but also important compounds exhibiting biological activity. It is well known that the formal [3+2] reaction of epoxides with nitriles under acidic conditions affords oxazolines, which can be easily converted to β-amino alcohols by hydrolysis. For our continuous studies of the tetraarylphosphonium salt-catalyzed reactions of epoxides, we herein report the reaction of epoxides with trichloroacetonitrile. The reaction of epoxides was carried out using 1.2 equiv of trichloroacetonitrile in the presence of a phosphonium salt catalyst (5 mol%), 2-methyl-2-butene (1.0 equiv) and MS4A in 1.0 M of chlorobenzene at 90 °C for 18 h. It was found that the corresponding β-amino alcohol derivatives **3** were obtained in good yields after hydrolysis of oxazolines **2** with use of *p*-toluenesulfonic acid.

Keywords : Phosphonium salt; Organocatalyst; Amino alcohol; Epoxide; Trichloroacetonitrile

β-アミノアルコールはビルディングブロックとして有用であるばかりでなく、医薬品や生理活性物質中に数多く含まれる極めて重要な化合物である。一般的に、酸性条件下、エポキシドとニトリル類の形式的[3+2]反応によりオキサゾリンが得られ、続く加水分解によりβ-アミノアルコールに変換できることが知られている。一方、当研究室では独自に開発したホスホニウム塩触媒によるエポキシドの変換反応の開発に取り組んでおり¹、今回その研究の一環としてエポキシドとトリクロロアセトニトリルの反応を検討したので報告する。

反応は、エポキシド **1** に対し 1.2 当量のトリクロロアセトニトリルを用い、ホスホニウム塩触媒 (5 mol%)、2-メチル-2-ブテン (1.0 当量) および MS4A 存在下、1.0 M のクロロベンゼン中、90 °C で 18 時間加熱攪拌する条件で行った。得られたオキサゾリン **2** を精製することなく、*p*-トルエンスルホン酸一水和物を用いて酸加水分解した。その結果、対応するβ-アミノアルコール誘導体 **3** が良好な収率で得られた。



1. Toda, Y.; Komiyama, Y.; Kikuchi, A.; Suga, H. *ACS Catal.* **2016**, *6*, 6906.