

## イソクマリン-3-カルボン酸エステルの効率的合成

(阪公大院理) ○濱本 健一郎・中山 淳・品田 哲郎

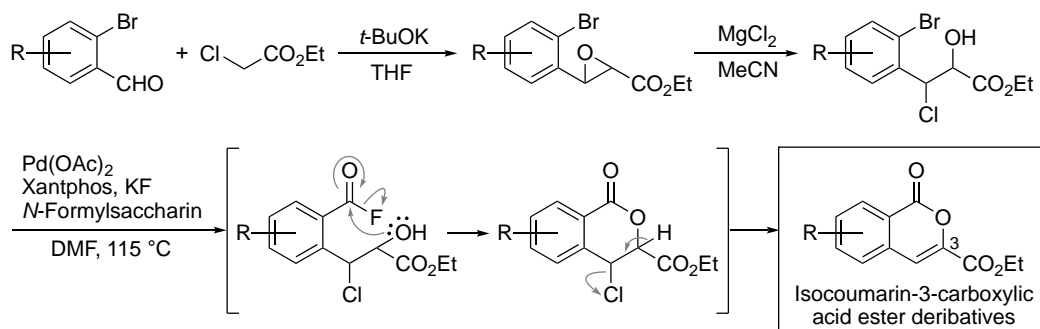
Efficient Synthesis of Isocoumarin-3-carboxylic Acid Ester Derivatives (*Graduate School of Science, Osaka Metropolitan University*)

○Kenichiro Hamamoto, Atsushi Nakayama, Tetsuro Shinada

Isocoumarin-3-carboxylic acid esters are often found as a substructure of biologically active isocoumarins. In this presentation, we would like to report an efficient synthesis of isocoumarin-3-carboxylic acid ester derivatives from readily available *o*-bromobenzaldehydes. Darzens condensation and ring opening of epoxides with  $\text{MgCl}_2$  gave  $\beta$ -chloro- $\alpha$ -hydroxy esters which were converted to isocoumarin-3-carboxylic acid esters by Pd catalyzed CO insertion/lactonization/ $\beta$ -elimination reaction in one step.

**Keywords:** Natural Product; Isocoumarin; Efficient Synthesis

イソクマリン-3-カルボン酸エステル構造は生物活性イソクマリン類の部分構造としてしばしば見出されている。興味深い生物活性を示すものが多く、合成研究が活発に行なわれてきた。今回、本構造の簡便な合成法を開発したので報告する。入手容易なオルトブロモベンズアルデヒド誘導体を Darzens 縮合によりグリシド酸エステルへと変換した後、 $\text{MgCl}_2$  を用いてエポキシドを開環し、対応する  $\beta$ -クロロ- $\alpha$ -ヒドロキシエステルへと導いた。触媒量の  $\text{Pd}(\text{OAc})_2$  を用いた CO 挿入 1) - ラクトン化 - 脱離連続反応を行うことで、アルデヒドから 3 段階でイソクマリン-3-カルボン酸エステルが合成できた。



1) T. Ueda, H. Konishi, K. Manabe, *Org. Lett.* **2013**, *15*, 5370.