

特殊ヘテロ 6 員環化合物 DATB の改良合成法の開発

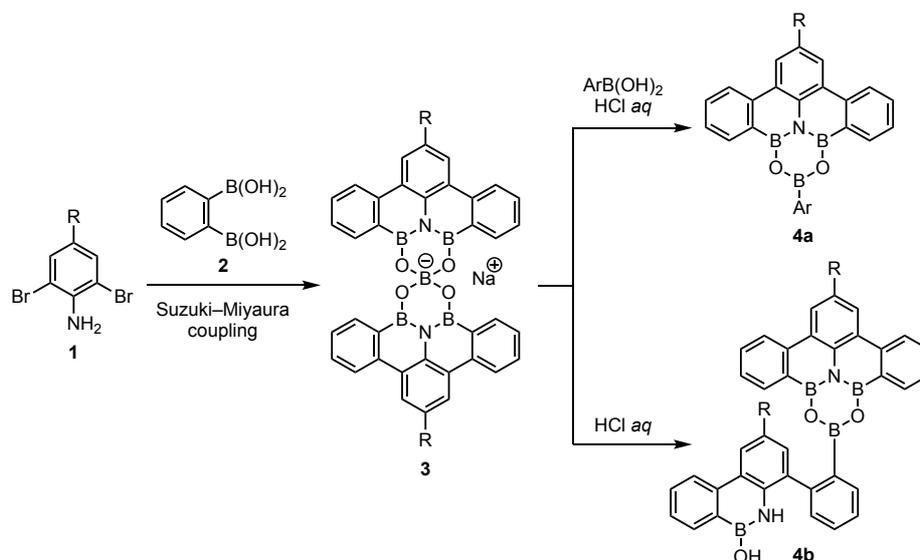
(慶大院薬¹・微化研²) ○堤 亮祐¹・柏木 伸章¹・熊谷 直哉^{1,2}

Improved Synthesis of DATB, a Unique Six-Membered Heterocycle (¹Graduate School of Pharmaceutical Sciences, Keio University, ²Institute of Microbial Chemistry) ○Ryosuke Tsutsumi,¹ Nobuaki Kashiwagi,¹ Naoyuki Kumagai^{1,2}

Our research group has reported a unique six-membered heterocycle, DATB (1,3-dioxa-5-aza-2,4,6-triborinane), which exhibited high catalytic activity in direct condensation between carboxylic acids and amines.¹ The synthesis of the DATB catalyst required a multi-step synthesis including a tedious purification process. In this study, we have developed an improved synthetic protocol for DATB catalysts from a commercial starting material which involves a two-step column-free process. In the presentation, we will report the details of this new synthetic method and its substrate generality.

Keywords : 1,3-dioxa-5-aza-2,4,6-triborinane; boron; amidation catalyst; spiroborate

我々は、炭素原子を一つも含まない特異な B₃NO₂ 型ヘテロ 6 員環を擁する DATB (1,3-ジオキサ-5-アザ-2,4,6-トリボリン) 分子が、カルボン酸とアミンの直接脱水縮合を促進する触媒として高い活性を示すことを報告している¹。従来、本触媒は 2,6-ジブロモアニリン誘導体 **1** から 4 段階かけて合成されており、その工程中に煩雑な精製操作や高価な試薬を必要としていた。今回、DATB 分子を同じ出発原料からカラムフリーの 2 工程で得られる改良合成法を開発した。**1** と 1,2-フェニレンジボロン酸 **2** との鈴木-宮浦カップリングにより得られた B-スピロ型ボラート **3** に対し、塩酸処理により簡便に DATB 化合物 **4a** および **4b** を合成できることを見出した。講演では、合成法の詳細と基質一般性について報告する。



1. Noda, H.; Furutachi, M.; Asada, Y.; Shibasaki, M.; Kumagai, N. *Nat. Chem.* **2017**, *9*, 571.