

Bi(OTf)₃ 触媒によるフェノールとアリルアルコールを用いた環化反応

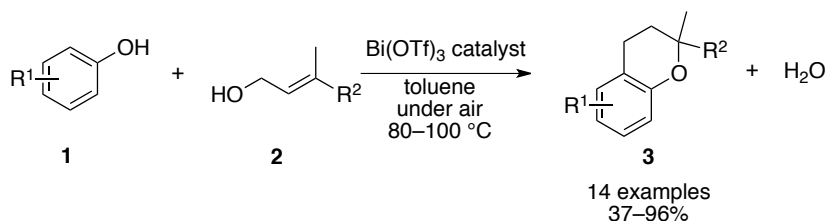
(山形大院理工) 佐藤 秀哉・〇皆川 真規

Bi(OTf)₃-catalyzed allylation/cyclization reactions of phenols with allyl alcohols (*Graduate School of Science and Engineering, Yamagata University*) Syuya Sato, 〇Maki Minakawa

Chroman scaffold are significant chemical structures due to their biological activities and pharmacological effects. The most commonly used strategy for the construction of the chroman framework is the acid-mediated intermolecular cyclization of phenols with 1,3-dienes by the Claisen rearrangement. The conventional methods usually require stoichiometric or substoichiometric amounts of acid promoters. Recently, we reported that Bi(OTf)₃-catalyzed intermolecular cyclization of naphthols with diols to give chroman derivatives.¹ This time, Bi(OTf)₃-catalyzed intermolecular cyclization of phenols with allyl alcohols was described. The reaction of phenol **1** (R¹=4-Me: 0.10 mmol) with allyl alcohols (R²=4-Me: 0.15 mmol) in toluene (0.2 mL) at 80 °C for 1 hour gave the corresponding chroman **3** (R¹=R²=Me) in 64% yield (Scheme). Under similar catalytic reaction conditions, various chroman derivatives (14 examples) were obtained in 37-96% yield.

Keywords : bismuth triflate; *O*-heterocycles; phenols; allyl alcohols; cyclization

クロマン骨格はその生体活性や薬理作用から有用な化学構造である。クロマン骨格構築法として最も用いられてきた手法は、フェノールと 1,3-ジエンの分子間環化反応(クライゼン転位)である。従来の方法では通常、化学量論的または準化学量論的な酸促進剤を必要とする。最近、我々はビスマストリフレート触媒を用いたナフトールとジオールの分子間環化反応によるクロマン誘導体合成を報告した。¹ 今回、ビスマストリフレート触媒を用いたフェノールとアリルアルコールの分子間環化反応を行った。具体的には、フェノール類 **1** (R¹= 4-Me: 0.10 mmol)とアリルアルコール **2** (R²=4-Me: 0.15 mmol)を、トルエン(0.2 mL)中ビスマストリフレート 5.0 mol%存在下、80 °C 1 時間で加熱攪拌したところ、目的のクロマン誘導体 **3** (R¹=R²=Me)を 64%収率で得た (Scheme)。同様の触媒反応条件下、様々なクロマン誘導体(14 種類)を 37-96%の収率で得ることに成功した。



Scheme Reaction of phenols with allyl alcohols in the presence of Bi(OTf)₃ catalyst

1) Minakawa, M.; Sakurai, Y. *Synlett*. **2022**, 33, 694.