

## 触媒的脱水素反応を利用したアミジン類とアリルアルコール類からのピリミジン類の合成

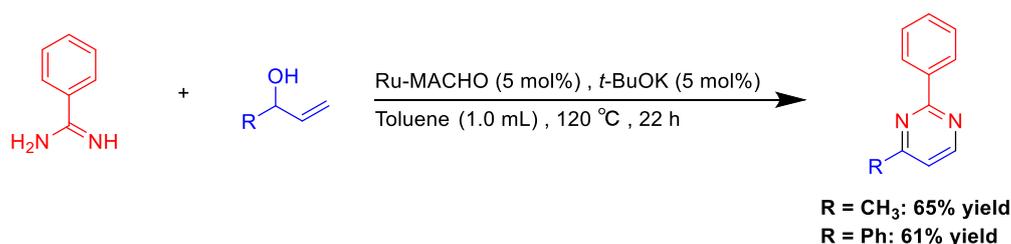
(同志社大生命) ○名須川 雄仁・中村 祐士・大江 洋平・太田 哲男  
 Synthesis of pyrimidines from amidines and allylic alcohols using catalytic dehydrogenation  
 (Department of Biomedical Information, Faculty of Life and Medical Sciences, Doshisha University) ○Takehito Nasukawa, Yushi Nakamura, Yohei Oe, Tetsuo Ohta

We developed the synthetic method of pyrimidines from easily available allylic alcohols and amidines using dehydrogenation catalyst. Thus, the reaction of benzamidine and 3-buten-2-ol or 1-phenyl-2-propen-1-ol with Ru-MACHO as a catalyst in toluene gave the corresponding desired products in up to 65% yield.

**Keywords :** Dehydrogenation; Pyrimidines; Amidines; Allylic Alcohols; Cyclization

ピリミジン骨格を有する化合物は生理活性を示すものも多く、医農薬品をはじめとして様々な用途で利用されている。ピリミジン骨格の構築手法として、 $\alpha,\beta$ -不飽和カルボニル化合物とアミジン類との反応を利用した手法が知られている。<sup>1,2)</sup> しかしながら、 $\alpha,\beta$ -不飽和カルボニル化合物は反応性が高くその合成や取扱いが難しいことから、よりアクセスが容易な基質の利用が求められる。このような背景から、本研究では、 $\alpha,\beta$ -不飽和カルボニル化合物の 1,2-還元体であり、安定かつ入手容易なアリルアルコール類に着目し、アリルアルコール類の触媒的脱水素による  $\alpha,\beta$ -不飽和カルボニル化合物の系内生成を鍵とした、新規触媒的ピリミジン合成手法の開発について検討した。

様々な検討の結果、Ru-MACHO 触媒存在下、アリルアルコール類として 3-buten-2-ol (R = CH<sub>3</sub>) あるいは 1-phenyl-2-propen-1-ol と、benzamidine との反応から目的とするピリミジン化合物が最大 65%の収率で得られることを見出した。本会では、基質適用範囲やその反応機構等について報告する。



- 1) K. S. Vadagaonkar, H. P. kalmode, K. Murugan, A. C. Chaskar, *Lett. Org. Chem*, **2015**, *12*, 447-458.
- 2) D. R. Fandrick, D. Reinhardt, J.-N. Desrosiers, S. Sanyal, K. R. Fandrick, S. Ma, N. Grinberg, H. Lee, J. J. Song, C. H. Senanayake, *Org. Lett*, **2014**, *16*, 2834-2837.