

## 1,2,3-トリアジン誘導体の[4+2]付加環化反応を利用した新規ピリミジン骨格の構築

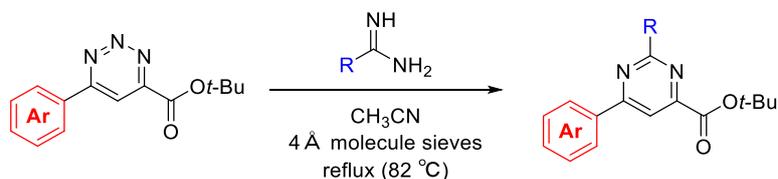
(青山学院大理工<sup>1</sup>) ○宇佐美 南<sup>1</sup>・楠 賢人<sup>1</sup>・松澤 明日香<sup>1</sup>・佐々木 郁雄<sup>1</sup>・杉村 秀幸<sup>1</sup>

Construction of novel pyrimidine skeleton using 1,2,3-triazine derivative (<sup>1</sup>College of Science and Engineering, Aoyama Gakuin University) ○Minami Usami,<sup>1</sup> Kento Kusunoki,<sup>1</sup> Asuka Matsuzawa,<sup>1</sup> Ikuo Sasaki,<sup>1</sup> Hideyuki Sugimura<sup>1</sup>

Pyrimidine derivatives are one of the nitrogen-containing heteroaromatic compounds that have attracted attention in recent years because they can be used in a wide range of highly value-added compounds such as drug candidates and organic electronic materials. We have found that 6-aryl-1,2,3-triazine-4-carboxylates are synthesized in three steps from  $\alpha$ ,  $\beta$ -unsaturated- $\alpha$ -keto esters prepared from aromatic aldehydes and pyruvate esters as starting materials. In this study, synthesis of various substituted pyrimidine derivatives using reverse electron demand [4+2] cycloaddition reaction of the obtained triazine derivatives with amidines was reported. We also report on the synthesis of pyrimidine derivatives using various amidines as dienophile with 6-phenyl-1,2,3-triazine-4-carboxylate as a heterodiene.

**Keywords** : 1,2,3-triazine derivative; amidine; pyrimidine derivatives

ピリミジン誘導体は、医薬品候補化合物や有機電子材料などの広範囲な高付加価値化合物に利用できることから、近年注目されている含窒素ヘテロ芳香族化合物の一つである。当研究室では、芳香族アルデヒドとピルビン酸エステルを出発物質として調製した  $\alpha, \beta$ -不飽和  $\alpha$ -ケトエステルから、さらに3工程を経て6-アリアル 1,2,3-トリアジン 4-カルボン酸エステルが生成することを見出している<sup>1,2)</sup>。本研究では、上記の反応により得られたトリアジン誘導体とアミジンの逆電子要請型[4+2]付加環化反応により様々な置換基を持つピリミジン誘導体の合成を検討した。まず、アリアル基として種々の電子求引性基や電子供与性基を有するフェニル基、チオフェン環やナフタレン環を持つトリアジンを用いて反応を行った。その結果、いずれも望むピリミジン誘導体を得ることができた。さらに、フェニル基を有するトリアジン誘導体を基質として、様々なアミジンを用いた反応についても併せて報告する。



1) N. Kishii, S. Negishi, T. Yamada, H. Sugimura, *Tetrahedron Lett.* **2015**, *56*, 2813-2816.

2) H. Sugimura, R. Takeuchi, S. Ichikawa, E. Nagayama, I. Sasaki, *Org. Lett.* **2018**, *20*, 3434-3437.