

サリチル酸あるいは α -アミノ酸誘導体とプロパルギル化合物の分子間環化反応におけるプロパルギル化合物の検討

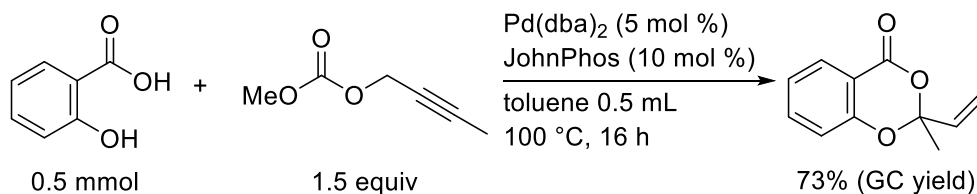
(東理大理工¹) ○鈴木 皓大¹・佐藤 和哉・荻原 陽平¹・坂井 教郎¹

Investigation of Propargylic Compounds in the Intermolecular Cyclization Reaction of Salicylic Acids or α -Amino Acids with Propargylic Compounds (¹ *Faculty of Science and Technology, Tokyo University of Science*)○Kodai Suzuki,¹ Kazuya Sato, Yohei Ogiwara,¹ Norio Sakai¹

Propargylic compounds have been widely used as substrates for heterocyclic synthesis in the presence of transition metal catalysts. In this reaction, propargylic compounds have been usually used as C2 or C3 components of heterocycles but rarely used them as the C1 component. On the other hand, we previously developed palladium-catalyzed intermolecular cyclization reaction between salicylic acid or α -amino acid derivatives and propargylic carbonates. Various nucleophiles such as salicylic acid can be applied to these reactions. However, the suitable substrates of propargylic compounds for these reactions weren't much examined. Therefore, we investigated the substrate scope with respect to propargylic compounds. Salicylic acid and 2-butyne-1-yl methyl carbonate were used, and the reaction was carried out in the presence of Pd(dba)₂ (5 mol %) and JohnPhos (10 mol %) in toluene at 100 °C for 16 hours, the desired compound was obtained in 73% GC yield.

Keywords : *Propargylic Compounds; Salicylic Acids; α -Amino Acids; Intermolecular Cyclization Reaction*

プロパルギル化合物は、遷移金属触媒存在下における複素環合成の基質として広く用いられている。複素環合成において、プロパルギル化合物は通常複素環の C2 または C3 成分として用いられているが、C1 成分として用いている場合はほとんど報告されていない。一方、当研究室では、パラジウム触媒によるサリチル酸あるいは α -アミノ酸誘導体と炭酸プロパルギルエステルを基質とした分子間環化反応を見出している¹⁾。これらの反応における誘導体検討については、サリチル酸等の求核分子は様々な検討が行われているが、プロパルギル化合物の検討はあまり行われていなかった。そこで我々はこれらの反応におけるプロパルギル化合物の検討を行った。サリチル酸と 2-ブチン-1-イル メチル炭酸エステルを基質とし、触媒の Pd(dba)₂ (5 mol %)と、配位子である JohnPhos (10 mol %)存在下、トルエン溶媒中 100 °C、16 時間の条件で反応を行ったところ、目的の化合物が GC 収率 73%で得られた。



1) Sato, K.; Ogiwara, Y.; Sakai, N. *Bull. Chem. Soc. Jpn.* **2020**, 93, 1595–1602.