

チアゾリン骨格を有する α -イミノエステル類縁体の極性転換反応

(三重大院工) 森 音菜・○清水健弘・溝田 功

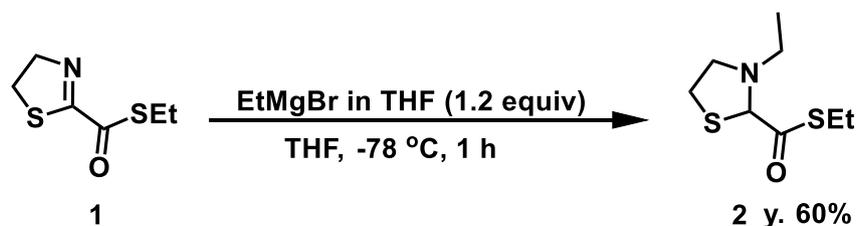
Umpolung Reaction of α -Iminoester Analogue having Thiazoline Skeleton (*Graduate School of Engineering, Mie University*) Nena Mori, ○Takehiro Shimizu, Isao Mizota

We have already reported that the umpolung reaction of α -iminester with various organometallic reagents proceeded smoothly to give the *N*-alkylated products in high yields. We have also found *N*-alkylation of α -iminothioesters proceeded to afford the corresponding *N*-alkylated products under mild conditions in a short time and subsequent C-C bond formation with the alkylthio rearrangement took place. In this study, we succeeded in the synthesis of α -iminothioester having thiazoline skeleton, and investigated *N*-alkylation reactions.

Keywords : Umpolung Reaction, *N*-Alkylation, Tandem Reaction, Thiazoline Skeleton

当研究室では、これまでに様々な α -イミノエステル類縁体に対して種々の有機金属反応剤を作用させることで、窒素原子上へのアルキル化反応(*N*-アルキル化)が進行し、対応する *N*-アルキル化体が高収率で得られることを見出している。^{1,2)}特に、 α -イミノチオエステルを出発物質に用いた場合、極めて温和でかつ短時間で *N*-アルキル化が進行し、続くアルキルチオ基の転位を伴うタンデム反応の開発に成功している。³⁾今回新たに、チアゾリン骨格を有する α -イミノエステル類縁体として α -イミノチオエステルを合成することに成功し、本基質に対し、*N*-アルキル化反応の検討を行ったので報告する。

チアゾリン骨格を有する α -イミノチオエステル **1** に対し、1.2 当量のエチル Grignard 反応剤を THF 溶媒中-78 °C で 1 時間反応させたところ、望みの *N*-アルキル化体 **2** を収率 60% で得た。



1) I. Mizota, M. Shimizu, *Chem. Rec.* **2016**, *16*, 688.

2) I. Mizota, Y. Nakamura, S. Mizutani, N. Mizukoshi, S. Terasawa, M. Shimizu, *Org. Lett.* **2021**, *23*, 4168.

3) I. Mizota, C. Ueda, Y. Tesong, Y. Tsujimoto, M. Shimizu, *Org. Lett.* **2018**, *20*, 2291.