

塩基触媒を用いるサリチルアルデヒド誘導体と 2-クロロエタンスルホニルクロリドとの反応

(中央大理工¹) ○川畑 和輝¹・福澤 信一¹

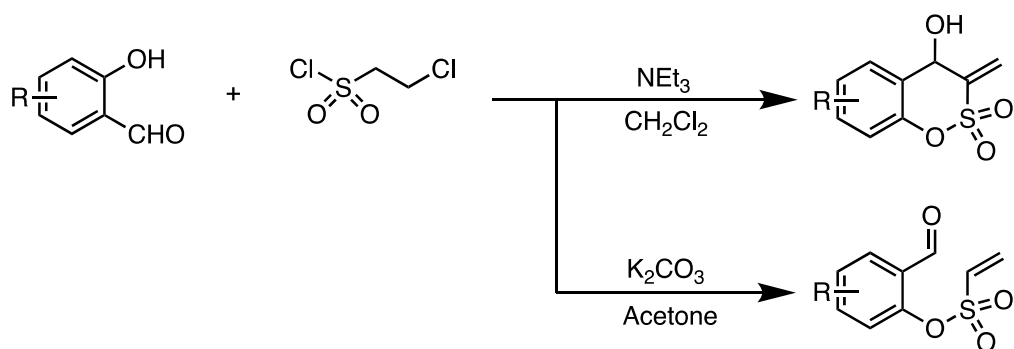
Base-catalyzed reaction of salicylaldehyde derivatives with 2-chloroethanesulfonyl chloride
(Department of Applied Chemistry, Faculty of Science and Engineering, Chuo University)

○Kazuki Kawabata¹, Shin-ichi Fukuzawa¹

Cyclic sulfonic acid esters (sultones) are heterocyclic compounds which are used in a variety of materials such as pharmaceuticals, so their efficient synthetic methods have been required.^[1] In this study, we found that when salicylaldehyde was treated with 2-chloroethanesulfonyl chloride and triethylamine, sultone derivatives are efficiently produced. The reaction involved sulfonic acid esterification, alkene formation by E2 elimination followed by intramolecular Morita-Baylis-Hillman (MBH) reaction. This reaction proceeds smoothly with substituted salicylaldehydes were used, and a wide range of sultone derivatives were synthesized. It was also revealed that when an inorganic base is used, the progress of intramolecular MBH is suppressed and an acyclic compound is produced.

Keywords : Morita-Baylis-Hillman Reaction; One-Pot Synthesis; Intramolecular Cyclization; Sulfonic acids Ester; Heterocyclic Compound

環状スルホン酸エステル(スルトン)は医薬品をはじめとする多彩な化合物に利用されているヘテロ環化合物であることから、その効率的合成法の開発が求められている。^[1] これに対し、本研究ではサリチルアルデヒドに 2-クロロエタンスルホニルクロリドとトリエチルアミンを作用させると、スルトン誘導体が効率良く生成することを見出した。これはスルホン酸エステルの形成と E2 脱離によるオレフィンの生成に引き続き、分子内 Morita-Baylis-Hillman (MBH) 反応が連続的に進行したためであると考えられる。本反応はサリチルアルデヒドに置換基を有する場合にも円滑に進行し、幅広いスルトン誘導体が合成できることが明らかになった。また、無機塩基を用いた場合には、分子内 MBH の進行を抑制し、非環式化合物を与えることも明らかにした。



[1] Ghandi, M. *et al*, *J. Org. Chem.* **2011**, 76, 9975–9982.