

ヨードピラゾールとアリルアルコールの C-O カップリング反応

(日大生産工¹⁾) ○中根 優輝¹・市川隼人¹

C-O coupling reaction of iode pyrazoles with allyl alcohols

(¹Graduate School of Industrial Engineering, Nihon University) ○Yuki Nakane,¹ Hayato Ichikawa

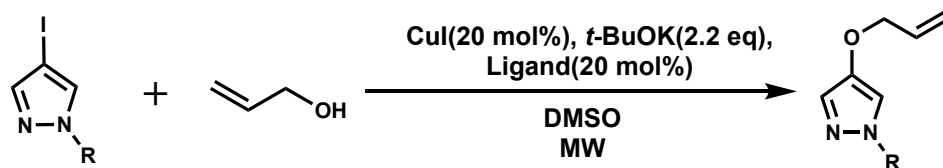
The importance of pyrazoles and their diverse biological activities, including their roles in antituberculosis, antibacterial, antifungal, anti-inflammatory, anticancer, and antidiabetic drugs have been widely emphasized, and as a result, they have attracted considerable interest from researchers. We have developed a total synthesis of withasomnine and its homologues, which are natural bioactive substances. However, the synthesis of the intermediate 4-allyloxy pyrazole is a multi-step reaction, and the synthetic route needs to improve and shorten. Recently, shortening of the synthetic route by a copper-catalyzed coupling reaction was reported, but it required much volume of alcohol as a solvent. Therefore, we investigated the reaction conditions for the coupling reaction using a reagent amount of alcohol.

In the previous study, Tr group was used as a substituent at the 1-position of pyrazole, but we confirmed that PMB group, was more suitable. Phenanthroline ligands among *N,N*-ligands was suitable as ligands for the copper catalyst.

Keywords : Organic Chemistry; Pharmaceutical Chemistry

ピラゾール類の重要性と抗結核薬、抗菌薬、抗真菌薬、抗炎症薬、抗癌薬、抗糖尿病薬など多様な生物活性は広く強調されており、研究者の大きな関心を集めている。本研究室では、天然の生理活性物質である withasomnine やその同族体を合成している¹⁾。しかし、中間体の 4-アリルオキシピラゾールの合成は多段階反応であり、合成経路の改善・短縮が求められている。近年、銅触媒を用いたカップリング反応による合成経路の短縮化が報告されたが、溶媒量のアルコールが必要であるという問題があった²⁾。そこで、我々は、試薬量のアルコールを用いたカップリング反応の反応条件を検討した。

ピラゾールの 1 位の置換基としては熱に強い PMB 基の方が適していた。また、銅触媒の配位子としては *N,N*-配位子の中でもフェナントロリン系配位子が適していた。



1) H. Ichikawa *et al.*, *Tetrahedron Lett.*, **2011**, 52, 4448.

2) Y. Usami *et al.*, *Molecules*, **2021**, 26, 3370.