

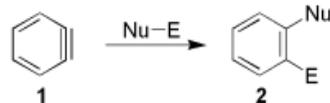
30E02-am05S

1,3-ジカルボニル化合物および環状ウレアとピリダインの反応による多置換ピリジンの合成

○中村 健一¹, 齋藤 望¹, 佐藤 美洋¹(¹北大院薬)

【目的】ベンザイン**1**に対し分子内に求核および求電子部位をもつ化合物(Nu-E)を反応させると、段階的な付加反応が進行し、2置換ベンゼン**2**が生成する (Scheme 1)¹⁾。一方、**1**の含窒素類縁体であるピリダインを用いた同様の反応例は極めて少ない²⁾。そこで今回我々はピリダインへの求核剤および求電子剤の連続的付加による多置換ピリジンの合成について検討した。

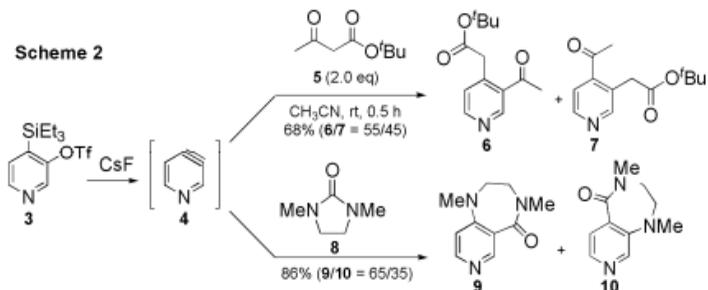
Scheme 1



【方法・結果】3,4-ピリダイン前駆体**3**³⁾とCsFから系中で発生させた3,4-ピリダイン**4**に対して、2当量のアセト酢酸t-ブチル(**5**)をアセトニトリル中、室温で反応させると68%の収率で2置換ピリジン**6**、**7**がおおよそ55対45の位置異性体比で得られた

(Scheme 2)。一方、**3**をCsF存在下、DMI(**8**)中、室温で反応させると、ピリジルジアゼピン化合物**9**、**10**が収率86%、位置異性体比65対35で得られた。本発表では置換基を有するピリダインを用いた位置選択的反応についても併せて報告する。

Scheme 2



1) Peña, D.; Pérez, D.; Guitián, E. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2006**, *45*, 3579. 2) Wang, A.; Tandel, S.; Zhang, H.; Huang, Y.; Holdeman T. C.; Biehl, E. R. *Tetrahedron* **1998**, *54*, 3391. 3) Tsukazaki, M.; Snieckus, V. *Heterocycles* **1992**, *33*, 533.