



## UNE METHODE SIMPLE, DOUCE ET EFFICACE DE DEPROTECTION DU N-Boc PAR $\text{Na}_2\text{CO}_3$ ♦

J. Koubachi<sup>1,2</sup>, S. El Kazzouli<sup>1,2</sup>, S. Berteina-Raboin<sup>1\*</sup>,  
A. Mouaddib<sup>2</sup>, G. Guillaumet<sup>1</sup>

<sup>1</sup>*Institut de Chimie Organique et Analytique, Université d'Orléans, UMR  
CNRS 6005, B.P. 6759, 45067 Orléans Cedex 2, France*

<sup>2</sup>*Faculté des Sciences et Techniques de Béni-Mellal, Université Cadi-  
Ayyad, BP 523, 23000 Béni-Mellal, Maroc.*

\*Correspondance : [sabine.berteina@univ-orleans.fr](mailto:sabine.berteina@univ-orleans.fr)

**Abstract:** We report here, the cleavage of N-Boc by treatment using  $\text{Na}_2\text{CO}_3$  with the reflux of a mixture DME/ $\text{H}_2\text{O}$ . This reaction is applied to various heterocyclic structures (azaindole, indazole, pyrazole, indolinone, quinolinone, oxazolone).

**Keywords:** *N-Boc,  $\text{Na}_2\text{CO}_3$ , azaindole, indazole, pyrazole, indolinone, quinolinone, oxazolone.*

### INTRODUCTION

Le *tert*-butyloxycarbonyl (Boc) est un des groupements protecteurs les plus utilisés en synthèse peptidique, nucléosidique ainsi qu'en chimie hétérocyclique.

---

♦ Paper presented at COFrRoCA 2006: Quatrième Colloque Franco-Roumain de Chimie Appliquée, 28 June – 2 July, Clermont-Ferrand, France

## CLIVAGE DE N-BOC

Plusieurs méthodes de déprotection ont été développées, en particulier, l'utilisation d'acides forts ou de Lewis [1]. En revanche, très peu de méthodes ont été décrites en milieu basique. A noter, la voie récemment développée par l'équipe de N. J. Tom [2] pour la déprotection des amines primaires utilisant un large excès de *t*-butoxide de sodium.

Selon une étude bibliographique d'autres méthodes de déprotection du *N*-Boc ont été mises au point telles que: le traitement thermique (150 °C) [3], le CAN [4] et le TBAF [5]. Nous présentons dans cette communication une voie simple, efficace et sélective de déprotection du *N*-Boc par traitement à l'aide de Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> au reflux d'un mélange DME/H<sub>2</sub>O [6] (Schéma 1).

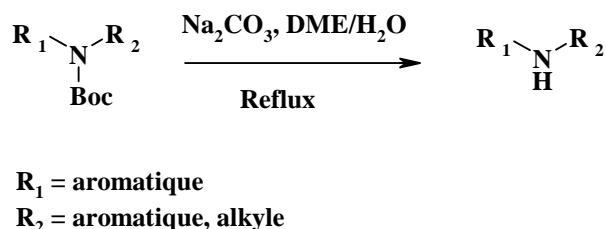


Schéma 1.

## CONCLUSION

Notre méthode a été appliquée avec succès pour la déprotection de diverses amines (indazole, indole, azaindole, indolinone, quinoline, pyrazole,...) qui ont été obtenues avec d'excellents rendements.

## REFERENCES BIBLIOGRAPHIQUES

1. Bose, D. S.; Kumar, K. K.; Reddy, A. V. N. *Synth. Commun.* **2003**, 33, 445.  
Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective groups in Organic Synthesis*, 3<sup>rd</sup> ed., John Wiley & Sons, **1999** and references cited therein.
2. Tom, N. J.; Simon, W. M.; Frost, H. N.; Ewing, M. *Tetrahedron Lett.*, **2004**, 45, 905.
3. Wasserman, H. H.; Berger, G. D.; Cho, K. R.; *Tetrahedron Lett.*, **1982**, 23, 465.
4. Kuttan, A.; Nowshudin, S.; Rao, M. N. A. *Tetrahedron Lett.*, **2004**, 45, 2663.
5. Routier, S.; Saugé, L.; Ayerbe, N.; Coudert, G.; Mérour, J.-Y. *Tetrahedron Lett.*, **2002**, 43, 589.
6. El Kazzouli, S.; Koubachi, J.; Berteina-Raboin, S.; Mouaddib, A.; Guillaumet, G. *Tetrahedron Lett.* Soumis.