

5-ヨードオキサゾールの新規合成反応開発とその誘導化

(千葉大理) ○齋藤 絢・東郷 秀雄

Novel Preparation of 5-Iodoxazoles and Derivatization

(Graduate School of Science, Chiba University) ○SAITO, Aya; TOGO, Hideo

Oxazoles are one of the most important nitrogen-containing heteroaromatics, since oxazole unit is contained in many biologically active natural products and pharmaceuticals. Moreover, oxazoles can be also used as versatile synthetic intermediates. However, most of those synthetic methods require transition metals, harsh reaction conditions or multi-step synthetic routes. Here, we have succeeded in one-pot preparation of 3-iodoxazole derivatives from imidates prepared from aromatic nitriles and alcohols, with iodine reagents under irradiation with a tungsten lamp, through radical cyclization of imino–nitrogen-centered radicals onto the aromatic ring. In addition, we have succeeded in transformation of 5-iodoxazoles into oxazole derivatives bearing other functional groups. So, detail results will be reported.

Keywords : Oxazole; DIH; Iminyl radical; One-pot reaction; Transition-metal free

代表的な含窒素芳香族複素環化合物であるオキサゾールは、薬理活性をもつ天然物や医薬品に見られる骨格で、医薬品や医薬品合成中間体として重要な化合物である。しかし、既存の合成法では遷移金属試薬や強酸条件、あるいは多段階工程を必要とするため、環境及び取り扱いの面で問題がある。そこで、我々は遷移金属等を用いることなく、ヨウ素の特性を利用した温和な条件下でのオキサゾール誘導体の新規合成法を検討した。本反応ではニトリルとアルコールから簡便に誘導できるイミデート **1** を出発物質とし、ヨウ素試薬存在下、光照射することにより、種々の 5-ヨードオキサゾール誘導体 **2** のワンポット合成に成功した。さらに、得られた 5-ヨードオキサゾールを様々な置換基を有する 3-置換オキサゾールに誘導化することに成功したので、その詳細を報告する。

