Beckmann 転位反応を用いた 6-位置換フェナンスリジン誘導体の

新規合成法開発

(千葉大院理) ○中村 航平・森山 克彦・東郷 秀雄

Novel Preparation of 6-Substituted Phenanthridines Through the Beckmann Rearrangement (Graduate School of Science, Chiba University) ONAKAMURA, Kohei; MORIYAMA, Katsuhiko; TOGO, Hideo

Phenanthridines are important units in pharmaceuticals and natural products due to a broad range of biological activities and functional abilities. Here, we have succeeded in one-pot preparation of 6-substituted phenanthridines through the Beckmann rearrangement and cyclization from the reactions of *anti o*-biphenyl ketoximes with trifluoromethanesulfonic anhydride. We also succeeded in derivatization using the obtained phenanthridines. So, detail results will be reported.

Keywords: Phenanthridine; Beckmann rearrangement; Cyclization; Transition-metal free; One pot

フェナンスリジンは幅広い生理活性や機能特性を有するため、多くの医薬品や機能材料等に含まれる重要な骨格である。今回、我々は $anti \sigma$ ビフェニルオキシムに無水トリフルオロメタンスルホン酸 (Tf_20)を作用させ、Beckmann 転位を伴った環化反応により、ワンポットで 6-位置換のフェナンスリジンが合成できることを見出した。また、得られたフェナンスリジンの誘導化にも成功したので、その詳細を報告する。

Tf₂O (2.0 eq.) Et₃N (0.5 mL)

Chlorobenzene (1.0 mL) r.t

$$0 \, ^{\circ}\text{C} \longrightarrow 120 \, ^{\circ}\text{C}$$
, 17 h

2

28 examples up to 99% yields