

イリジウム(III)錯体光増感剤存在下における 1,2,5-オキサジアジナン誘導体のフロー合成および化学選択的変換

(北里大薬¹・北里大理²) ○中原 大生²・伊藤 謙之介¹・水口 貴章¹・唐木 文霞¹・平山 重人¹・長井 賢一郎¹・佐藤 倫子¹・弓削 秀隆²・藤井 秀明¹

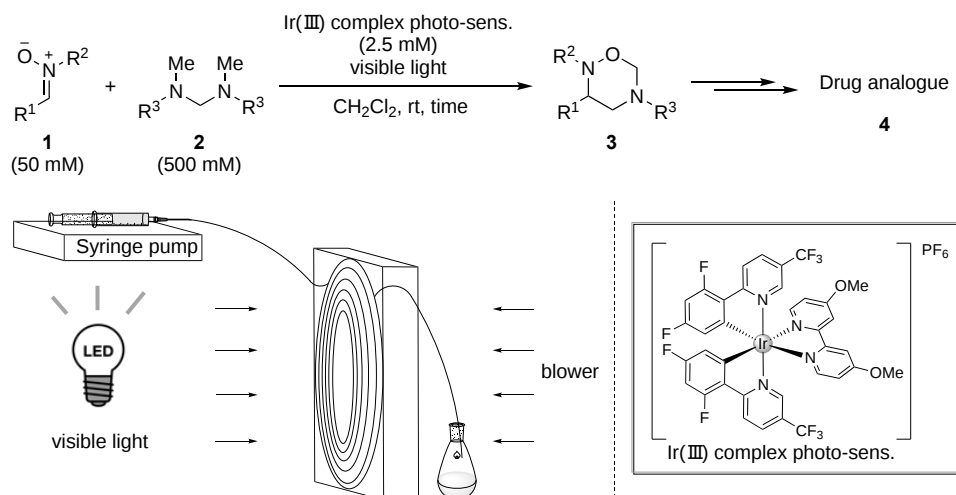
Flow Synthesis of 1,2,5-Oxadiazinane Derivatives in the Presence of Iridium(III) Complex Photosensitizers and Their Chemoselective Transformation

(¹Kitasato Univ. Pharm., ²Kitasato Univ. Sci.) ○Hiroki Nakahara,² Kennosuke Itoh,¹ Takaaki Mizuguchi,¹ Fumika Karaki¹ Shigeto Hirayama,¹ Kenichiro Nagai,¹ Noriko Sato,¹ Hidetaka Yuge,² Hideaki, Fujii¹

Novel 1,2,5-oxadiazinane derivatives **3** were synthesized by the reaction of nitrones **1** with α -aminoalkyl radicals generated from diaminomethanes **2** under visible-light irradiation. An iridium complex photosensitizer (5 mol%) catalyzed the reaction. The rate of the flow reactions increased obviously in comparison with that of batch reactions. We also successfully accomplished a chemoselective transformation of **3** and derivatization of **3** to a drug analogue **4**.

Keywords : Flow Synthesis; Visible-Light; Iridium(III) Complex; Chemoselective Transformation; 1,2,5-Oxadiazinane

我々は、イリジウム(III) 錯体光増感剤¹⁾、ニトロソ **1**、ジアミノメタン **2** の混合溶液に可視光を照射すると、**2** から生じた α -アミノアルキルラジカルが **1** に付加した後に分子内環化するという、形式的 [3+3] 光付加環化反応による 1,2,5-オキサジアジナン **3** の合成法を開発した。本反応は、バッチ法では反応が完結するまでに長時間を要する場合があったが、独自に設計・作成したフローリアクターを用いることにより、反応速度を増大させること、および **3** の収率を向上させることができた。また、**3** の化学選択的変換についても達成し、医薬品アナログ **4** へと誘導した。



1) Itoh, K.; Nagao, S.; Tokunaga, K.; Hirayama, S.; Karaki, F.; Mizuguchi, T.; Nagai, K.; Sato, N.; Suzuki, M.; Hashimoto, M.; Fujii, H. *Chem. Eur. J.* **2021**, 27, 5171.