

超原子価ヨウ素(Ⅲ)化合物を用いた酸化的アリール転位による 1,3-テトラヒドロオキサジンの合成

(千葉大院理) ○鈴木 まみ・森山 克彦

Synthesis of 1,3-Tetrahydrooxazines by Oxidative Aryl Rearrangement Using Hypervalent iodine (III) Compound (*Graduate School of Science, Chiba University*) ○Mami Suzuki, Katsuhiko Moriyama

Hypervalent iodine compounds have been utilized as organic reagents in lieu of heavy metals to achieve various transformations. In particular, aryl rearrangement reaction using hypervalent iodine compounds has attracted considerable attention as reaction with excellent atom economy. In this work, we developed the synthesis of disubstituted 1,3-tetrahydrooxazines by oxidative aryl rearrangement of *N*-4-methoxybenzyl-*N*-cinnamylsulfonamides using [hydroxy(tosyloxy)iodo]benzene (Koser reagent) as hypervalent iodine(III) compound.

Keywords : Hypervalent Iodine; Aryl Rearrangement; Dearomatization; Intramolecular Cyclization; Heterocycle

超原子価ヨウ素化合物は、重金属代用型試薬として様々な分子変換反応に利用されている。特に、超原子価ヨウ素化合物を用いたアリール転位反応は、アトムエコノミーの優れた反応として注目を集めている。一方、1,3-テトラヒドロオキサジン骨格は、多くの生理活性化合物に含まれる重要な骨格であり、また、 γ -アミノアルコール誘導体等、様々な官能基に変換できるため、この化合物の効率的合成法の確立は有用である。今回我々は、3価の超原子価ヨウ素化合物を用いた *N*-4-メトキシベンジル-*N*-シンナミルスルホンアミドの酸化的アリール転位による二置換 1,3-テトラヒドロオキサジンの合成に成功した。

実際に、*N*-4-メトキシベンジル-*N*-シンナミルスルホンアミド(**1**)と[ヒドロキシ(トシルオキシ)ヨード]ベンゼン(Koser 試薬)を、ジクロロメタン中、室温で反応させたところ、目的の二置換 1,3-テトラヒドロオキサジン(**2**)が高収率で得られた。また、様々な置換を有する *N*-4-メトキシベンジル-*N*-シンナミルスルホンアミド誘導体の反応においても、対応する二置換 1,3-テトラヒドロオキサジンが中程度から良好な収率で得られた。さらに、単結晶 X線構造解析により、目的生成物の相対配置が明らかとなった。

