

芳香環への酸素官能基導入反応の新展開

4H-1,2-Benzoxazines as Potent Intermediates for Oxygen-Functionalized Aromatic Compounds

○大和田 智彦¹(¹東大院薬)

芳香族化合物、すなわち芳香環を有する化合物の合成化学の問題点は、芳香環上の官能基の種類および配置の多様性の創出力の低さにある。すなわち出発物質としての供給されている多官能芳香族化合物の種類が少なくまた芳香環への官能基導入反応も大きな制限を持つ。例えば、芳香環に酸素官能基を導入する一般性の高い反応は今まで知られていない。2-アリアルニトロエタンが超強プレンステッド酸であるトリフルオロメタンスルホン酸によって新規ヘテロ環である 4H-1,2-ベンツオキサジン **1** を生成する反応を最近我々は発見した(下図)。本反応の特徴として a)ベンゼン環上の置換基がエステル、アミド、ニトリル、トリフルオロメチル基、ニトロ基という強力な電子求引性の官能基であっても収率よく環化すること、b) 得られた 4H-1,2-ベンツオキサジン **1** から連続的にフェノール誘導体に誘導可能であることなどを明らかにした。この反応(オルト位酸素官能基化)の発見の経緯を紹介する。

