

# 28P-am165

超原子価ヨウ素化合物による分子内アミノ環化反応と生理活性物質の改良合成  
○角田 広子<sup>1</sup>, 桐原 正之<sup>2</sup>, 高橋 康丈<sup>1</sup>(<sup>1</sup>富山大院医, <sup>2</sup>静岡理工大理工)

【目的】超原子価ヨウ素化合物を用いるアルケニルアミンの分子内アミノ環化反応により、含窒素ヘテロ環の構築と生理活性物質の改良合成をめざす。

【方法および結果】すでに種々のアルケニルアミン類に対して超原子価ヨウ素化合物による環化反応を検討しているが、キラルな 2,3-dihydroxy-4-pentenylamine の Cbz 保護体から PhI(OH)OTs による環化反応は、アミノ環化と同時に 2 位水酸基からさらに環化して一挙に 2-oxa-5-azabicyclo[2.2.1]heptane 骨格を有する生成物を与えた。一方 diacetate 体に PhI(OAc)<sub>2</sub> / BF<sub>3</sub>-OEt<sub>2</sub> を作用させたところ、piperidine 体の生成が優先したうえに、環化の際の二重結合に対する面選択性が低下したため bicyclic oxazolidinone 体は diastereomer 混合物として得られた。これらは容易に分離可能であったのでオールシス体を生理活性物質へと変換できたが、環化の収率に問題が残った。そこで今回は diol の一方のみを保護した基質 (2 位置換体) を合成し、環化を検討することにした。

