26C-am08

スチレン類とスルホンアミドを用いるアジリジン光環化反応の開発 ○松澤 一樹', 苅谷 篤賢', 山口 英士', 多田 教浩', 三浦 剛', 伊藤 彰近' ('岐阜薬大, ²東京薬大薬)

【目的】アジリジンは、生物活性物質に存在する骨格であることに加えて高い反 応性を有するために、非常に有用な合成中間体として利用されてきた。そのため、 これまでに様々なアジリジン合成法が開発されているが、それらのほとんどは環 境負荷の高い重金属触媒や不安定な窒素源を用いている。一方、当研究室では安

価で取り扱いやすいスルホンアミドを窒素源とするアジリジン環化反応を実現す

べく検討を行った。 【方法・結果】スチレン類とスルホンアミドを溶媒に溶解させ、各種ヨウ素源及 び添加物存在下、アルゴン雰囲気中で汎用の蛍光灯からの光を外部照射した。そ の結果、ジクロロメタン中、ヨウ素源として単体ヨウ素、添加剤として炭酸カリ ウムを用いると良好な結果が得られた。また本反応の一般化についても検討を行 い、種々のアジリジン類を良好な収率で得ることに成功した。

$$\begin{array}{c} \text{Ar, } \hbar\nu(\text{VIS}) \\ \text{I_2 (1.0 equiv)} \\ \text{Me} \\ \text{(2.0 equiv)} \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} \text{Ar, } \hbar\nu(\text{VIS}) \\ \text{I_2 (1.0 equiv)} \\ \text{DCM (5 mL), 20 h} \\ \end{array} \\ \text{Proposition of the properties of the pr$$