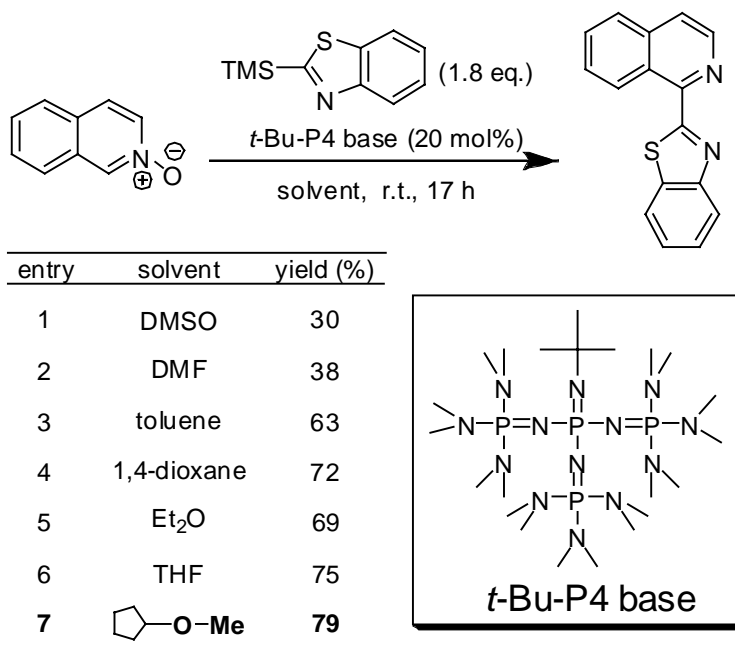


## フォスファゼン塩基触媒を用いる芳香複素環 N オキシドの選択的変換反応

(東北大院薬) 荒木 勇太、小林 耕土、根東 義則

複素環化合物は多くの医薬品に含まれる構成単位であり、これらの誘導体合成法の研究は医薬品の開発において有益であるといえる。よって、複素環化合物誘導体の合成法は以前から活発に行われていた。これまでの合成法では遷移金属触媒が精力的に研究されてきたが、近年有機触媒を用いる反応が注目されている。当研究室ではフォスファゼン塩基の1つである *t*-Bu-P4 塩基<sup>1)</sup>が有機ケイ素化合物を触媒的に活性化し、種々の求電子剤と反応することを報告している<sup>2)</sup>。そこで、筆者らは複素環 N オキシドを求電子剤とし、種々の有機ケイ素化合物を、*t*-Bu-P4 塩基触媒下で反応させることで、複素環化合物誘導体の合成が達成されるものと考え、本研究を行うこととした。

イソキノリン N オキシドと 1.8 当量の 2-トリメチルシリルベンゾチアゾールを 20 mol% の *t*-Bu-P4 塩基触媒下、反応時間 17 時間、種々の溶媒中にて反応を行った。その結果、シクロペンチルメチルエーテルを用いた場合に 79 % と最も高い収率で目的とする 1-(2-ベンゾチアゾリル)イソキノリンが得られた。現在、更なる反応条件の最適化と基質の適用範囲について検討を行っている。



1) Schwesinger, R.; Schlemper, H. *Angew. Chem. Int. Ed.* **1987**, 26, 1167-1169.

2) a) Ueno, M.; Hori, C.; Suzawa, K.; Ebisawa, M.; Kondo, Y. *Eur. J. Org. Chem.* **2005**, 1965-1968. b) Kobayashi, K.; Ueno, M.; Kondo, Y. *Chem. Commun.* **2006**, 3128-3130. c) Suzawa, K.; Ueno, M.; Wheatley, A. E. H.; Kondo, Y. *Chem. Commun.* **2006**, 4850-4852. d) Ueno, M.; Yonemoto, M.; Hashimoto, M.; Wheatley, A. E. H.; Naka, H.; Kondo, Y. *Chem. Commun.* **2007**, 2264-2266.