

3-シアノ-5-アシルイソキサゾールの合成

1160189 岩井 健人

Synthesis of 3-Cyano-5-acylisoxazoles

Kento Iwai

生理活性物質の基本構造として、あるいはその合成中間体として重要な多官能イソキサゾール骨格の簡便な構築法の開発を検討した。ニトロイソキサゾロンのピリジニウム塩 **1** にアミンを作用させることにより生成するシアノアシニトロ酢酸塩 **2** を、 α -クロロ- α, β -不飽和ケトン **3** に対するマイケル付加、およびそれに続く環化反応を行なうことにより、多官能イソキサゾール **4** を得た。また、反応条件の最適化により高収率でイソキサゾール **4** を得ることに成功した。本反応の特長は α, β -不飽和ケトン **3** の置換基を替えるのみで容易にイソキサゾール **4** の修飾が行えることであり、種々のイソキサゾール類 **4** の合成が可能であることも明らかにした。また、得られたイソキサゾール類 **4** は多官能性を有し多様な反応性を示すことが期待されることから、その化学変換についても検討を行った。

