

〔Heterocycles, 9, 1413 (1978)〕

A New Ring Transformation of Benzothiazolines to 3-Oxo-2,3-dihydro-4H-1,4-benzothiazines or benzothiazoles

MIKIO HORI, TADASHI KATAOKA, HIROSHI SHIMIZU, YUTAKA IMAI

Benzothiazoline 類の 3-Oxo-2,3-dihydro-4H-1,4-benzothiazine 類あるいは Benzothiazole 類への新規な環変換反応

堀 幹夫, 片岡 貞, 清水 洋, 今井 豊

2,2-Disubstituted benzothiazoline 類と chloroacetyl chloride の反応から benzothiazoline 類の新規な環変換反応を見出した。2,2-dimethylbenzothiazoline(1) を  $K_2CO_3$  存在下に chloroacetyl chloride と反応させると chloroacetyl 体(2)の他に 3, 4, 5 が生成した。一方, 2位のフェニル基の立体効果によってより活性化された 2-methyl-2-phenylbenzothiazoline からは, 同条件下の反応により環拡大生成物(3, 4)のみが生成した。反応混合物の NMR スペクトルによる中間体, S-(2-isopropylideneaminophenyl) thiochloroacetate(6) hydrochloride の確認, ならびに第2の中間体, N, S-diacyl o-aminobenzenethiol (7) の単離に基づき, 上記環変換反応の機構を明らかにした。

