

[Chem. Pharm. Bull. (Tokyo), 27, 1982 (1979)]

Studies on Benzothiazoline Derivatives. IV.

Synthesis and Novel Ring Expansion Reaction of Benzothiazoline Sulfoxides

MIKIO HORI, TADASHI KATAOKA, HIROSHI SHIMIZU, YUTAKA IMAI

Benzothiazoline 誘導体に関する研究 (第4報)

Benzothiazoline Sulfoxide 類の合成と新規な環拡大反応

堀 幹夫, 片岡 貞, 清水 洋, 今井 豊

2-置換 benzothiazoline 類 (1) を N-アシル化して得られる 3-acylbenzothiazoline 類 (2) を *m*-chloroperbenzoic acid で酸化し, 対応する 3-acylbenzothiazoline sulfoxide 類 (3) を高収率で合成した。3には, それぞれ *cis*, *trans* 異性体があり, それらの立体構造を, ASIS を含む NMR スペクトルの詳細な解析により決定した。

3-Acetylbenzothiazoline sulfoxide 類 (3, R<sub>1</sub>=CH<sub>3</sub>) を無水酢酸中加熱還流させると, 環拡大反応により benzothiazine 類 (5,6) が生成した。本反応が benzothiazine 類の一般的合成法として有用であることを, 各種の反応例から認めた。この新規な環拡大反応の機構として, sulfenic anhydride (4) を中間体とする経路を考察した。

