## ヨウ素/アンモニウムヨージド触媒系によるイミノヨージナンを窒素源としたスチレン誘導体のアジリジン化反応

（阪大院工1・京大院工2）清川 謙介1・○小坂 知輝1・南方 聖司1・近藤輝幸2

Aziridination of Styrene Derivatives Using Iminoiodinane Catalyzed by Iodine and Ammonium Iodide (1*Graduate School of Engineering, Osaka University*, 2*Graduate School of Engineering, Kyoto University*) Kensuke Kiyokawa,1 ○Tomoki Kosaka,1 Satoshi Minakata,1 Teruyuki Kondo2

Aziridines have been recognized as an important structural motif in natural products and also a useful building block in organic synthesis. In numerous synthetic methodologies of aziridines, iminoiodinanes have been most widely used as a nitrogen source. However aziridination using iminoiodinanes under metal-free conditions has not been developed. We present here a metal-free catalytic aziridination of styrene derivatives with an equimolar amount of PhI=NTs in the presence of I2 in combination with tetrabutylammonium iodide (TBAI). Employing I2 (10 mol%) and TBAI (5 mol%) as a catalyst for the reaction of styrene with PhI=NTs in acetonitrile at room temperature afforded the corresponding aziridine in 93% yield. This catalytic system is applicable to various styrene derivatives bearing electron-donating or electron-withdrawing groups, and also cyclic styrene derivatives. **【これで 124 words です。参考にして下さい。】**

*Keywords：Aziridine; Iminoiodinane; Metal Free; Iodine; Ammonium Iodide* **【最大5 words】**

アジリジン骨格は天然物中に多く見られるだけでなく、その環ひずみの大きさから容易に開環するため、多くの含窒素化合物の合成中間体としても有用である。最も有用なアジリジンの合成法としてアルケンからの直接変換反応が挙げられる。その一つにイミノヨージナンを窒素源とした、遷移金属触媒を用いるアジリジン合成は広く研究されている。しかし、イミノヨージナンを用いたメタルフリー条件下でのアジリジン合成は未だ達成されていない1)。本研究では、アンモニウム塩とヨウ素を組み合わせた触媒系を活用することにより、イミノヨージナンを窒素源としたアルケンからの効率的なアジリジン合成を達成した。

実際に、スチレンとイミノヨージナンの反応を、アセトニトリル中、ヨウ素10 mol%存在下で行った場合、目的のアジリジンが55%収率で得られた。さらに、テトラブチルアンモニウムヨージド (TBAI) を5 mol%添加したところ、収率は著しく向上した。**【これで 389 文字です。参考にして下さい。】**



1) Iodine-catalyzed amidation reaction using iminoiodinane has been reported. A. A. Lamar, K. M. Nicholas, *J. Org. Chem.* **2010**, *75*, 7644.