

分子内 Michael 反応を利用する中環状 複素環式化合物の合成

舩岡 豊*, 朝子 典彦*, 後藤 義一*, 野口 俊作

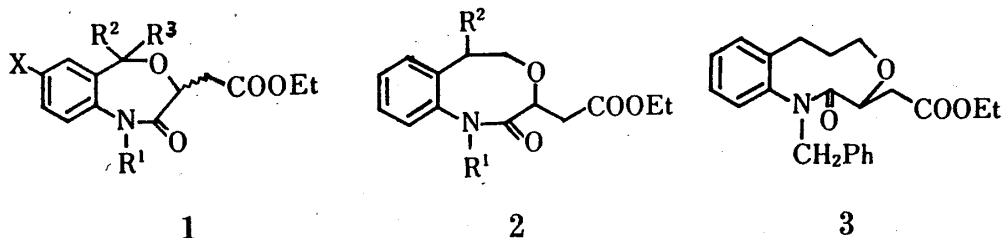
Chemical & Pharmaceutical Bulletin, 34(1), 140-149 (1986)

Syntheses of Medium-Sized Heterocycles Using an Intramolecular Michael Reaction

Yutaka MASUOKA*, Tsunehiko ASAKO*, Giichi GOTO*,
and Shunsaku NOGUCHI

ABSTRACT: 1,2,3,5-Tetrahydro-2-oxo-4,1-benzoxazepine-3-acetates(1), 2,3,5,6-tetrahydro-2-oxo-1H-4,1-benzoxazocine-3-acetates(2) and 1,2,3,5,6,7-hexahydro-2-oxo-4,1-benzoxazonine-3-acetate(3), which include a GABA and / or a GABOB moiety, were obtained from 3-[[2-(ω -hydroxyalkyl) phenyl]-carbamoyl] acrylates by the intramolecular Michael addition. Among the compounds synthesized, some benzoxazepine compounds showed considerable anxiolytic activity.

抄録 GABA あるいは GABOB の構造を分子内にもつ化合物として1,2,3,5-tetrahydro-2-oxo-4,1-benzoxazepine-3-acetates (1), 2,3,5,6-tetrahydro-2-oxo-1H-4,1-benzoxazocine-3-acetates (2)及び1,2,3,5,6,7-hexahydro-2-oxo-4,1-benzoxazonine-3-acetate (3)が3-[[2- ω -hydroxyalkyl)-phenyl] carbamoyl] acrylates の分子内 Michael 付加反応により合成された。薬理試験の結果, いくつかの benzoxazepine 化合物にかなりの抗不安作用が認められた。



* Central Research Division, Takeda Chemical Industries, Ltd.

武田薬品工業(株)中央研究所