

[Chem. Pharm. Bull. (Tokyo), 27, 1973 (1979)]

**Studies on Benzothiazoline Derivatives. III* Reactions of
2,2-Disubstituted Benzothiazolines with Haloacyl Halides
or Acid Anhydrides**

MIKIO HORI, TADASHI KATAOKA, HIROSHI SHIMIZU, YUTAKA IMAI

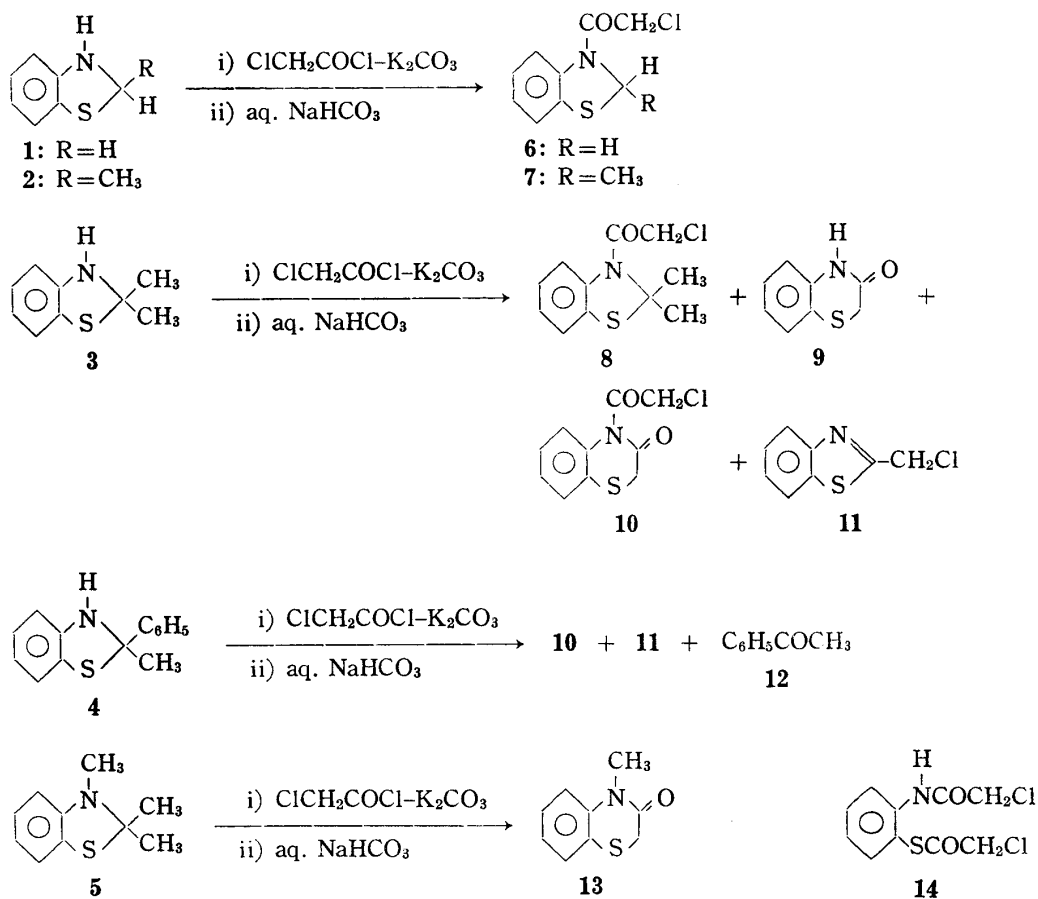
Benzothiazoline 誘導体に関する研究 (第3報*)

2,2-ジ置換 Benzothiazolines と Haloacyl Halides および酸無水物の反応

Benzothiazoline (1)や 2-methyl 誘導体 (2) と chloroacetyl chloride の反応では, N-chloroacetyl 化が起こるのみであるが, 3,3-dimethyl 誘導体 (3) では, chloroacetyl 体 (8) の他に, 環変換反応した生成物 (9-11) が生成することを見出した。他の 2,2-ジ置換誘導体 (4,5) においても, 環変換生成物が得られた。

この反応の key intermediate は N,S-bis (chloroacetyl)-o-aminobenzenethiol (14) であることが, 明らかとなった。

一方, 酸無水物との反応では, N-acyl 化が起こるが, キシレン中で還流する様な強い条件下では, benzothiazole 誘導体を生成した。



*第2報 薬学雑誌, 98, 1019 (1978)