

Organic Preparations and Procedures International, 14 (6), 399–403 (1982)

An Efficient Synthesis of *N'*-(*o*-Alkoxyphenyl)-pyridine-
carboxamide Derivatives

Takuzo Hisano, Masanobu Tasaki, Toshikazu Matsuoka
and Masataka Ichikawa

Faculty of Pharmaceutical Sciences, Kumamoto University

アルコキシフェニルピリジンカルボキサミジン誘導体の合成法の開発

久野拓三, 田崎正信, 松岡俊和, 市川正孝

熊本大学薬学部

抄録 非ステロイド系抗炎症薬は最近活発に開発されているが、酸性物質が多く、胃に対する副作用が報告されている。そこで、構造上中性を保持し、分子状として吸収され易い抗炎症薬の開発を目的としてピリジンカルボキサミジンを基本骨格とする誘導体の合成法を検討した。シアノピリジン類はアニリン類と塩化アルミニウムを縮合剤としてアミジン結合を形成するが、アルコキシ基が存在すると、塩化アルミニウムと反応して脱アルキルが起り、さらに樹脂化を併発してアミジン結合の収率を著しく低下させる。そこで、ナトリウムアミドを塩化アルミニウムの代りに縮合剤として利用する方法を開発した。すなわち、 -50°C の条件下で液体アンモニア中でシアノピリジン、アニリン類およびナトリウムアミドを反応させると脱アルキル、樹脂化などの副作用を抑制することができ、多くのアルコキシフェニルピリジンカルボキサミジン誘導体を収率良く合成することができた。これらの化合物は抗炎症作用薬としての動物実験に供している。